

This Page Is Inserted by IFW Operations
and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

**As rescanning documents *will not* correct images,
please do not report the images to the
Image Problem Mailbox.**

PCT

世界知的所有権機関
国際事務局

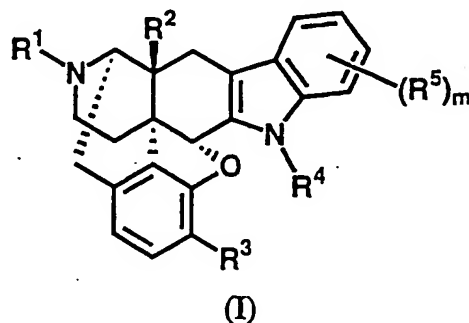
特許協力条約に基づいて公開された国際出願



(51) 国際特許分類 C07D 491/18, A61K 31/485	A1	(11) 国際公開番号 WO98/31684 (43) 国際公開日 1998年7月23日 (23.07.98)
(21) 国際出願番号 PCT/JP98/00092 (22) 国際出願日 1998年1月13日 (13.01.98) (30) 優先権データ 特願平9/5829 1997年1月16日 (16.01.97) JP (71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 東レ株式会社(TORAY INDUSTRIES, INC.)[JP/JP] 〒103 東京都中央区日本橋室町2丁目2番1号 Tokyo, (JP) (72) 発明者; および (75) 発明者/出願人 (米国についてののみ) 長瀬 博(NAGASE, Hiroshi)[JP/JP] 〒247 神奈川県鎌倉市梶原2-10-4 Kanagawa, (JP) 今村芳文(IMAMURA, Yoshifumi)[JP/JP] 〒248 神奈川県鎌倉市津西2-1-20-L103 Kanagawa, (JP) 廣川順一(HIROKAWA, Junichi)[JP/JP] 〒248 神奈川県鎌倉市手広1111-204 Kanagawa, (JP) 松田 進(MATSUDA, Susumu)[JP/JP] 〒251 神奈川県藤沢市鶴沼松が岡2-13-12 Kanagawa, (JP) 宮内 泰(MIYAUCHI, Yasushi)[JP/JP] 〒248 神奈川県鎌倉市津西2-1-20-L304 Kanagawa, (JP)	(81) 指定国 AU, CA, CN, JP, KR, NO, NZ, US, 欧州特許 (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE). 添付公開書類 国際調査報告書	
<p>(54)Title: INDOLOMORPHINANE DERIVATIVES AND REMEDIES/PREVENTIVES FOR CEREBRAL DISORDERS</p> <p>(54)発明の名称 インドロモルヒナン誘導体および脳障害治療・予防剤</p> <p>(57) Abstract</p> <p>Indolomorphinane derivatives represented by general formula (I) or pharmacologically acceptable acid-addition salts thereof, and remedies/preventives for cerebral disorders containing the same, wherein R¹ represents cyclopropylmethyl, etc.; R² and R³ represent each hydroxy, methoxy, etc.; R⁴ represents hydrogen, methyl, benzyl, 3-isothio-cyanatopropyl, etc.; and (R⁵)_m represents hydrogen, substituted benzo etc. It has been clarified that the above compounds have excellent preventive effects on cranial nerve disorders. Thus, these compounds are useful as drugs for inhibiting various ischemic, hemorrhagic or traumatic cerebral disorders and cranial nerve disorders caused by various nerve degenerations, treating and preventing various cerebral diseases such as cerebral stroke, traumatic cerebral disease, cerebral edema and cranial nerve degeneration disease, ameliorating the after-troubles thereof, and preventing the recurrence thereof.</p> <div data-bbox="711 1262 1312 1528"><p>(I)</p></div>		

(57) 要約

本発明は、一般式 (I)



[式中、R¹はシクロプロピルメチルなど、R²およびR³はヒドロキシ、メトキシなど、R⁴は水素、メチル、ベンジル、3-イソチオシアナトプロピルなど、(R⁵)_mは水素、置換ベンゾなどを表す。]で表されるインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩、およびそれらからなる脳障害治療・予防剤を提供する。

本発明の化合物は、脳神経細胞障害に対する優れた防御効果を有していることが明らかになった。従って、本発明の化合物は、様々な虚血性、出血性、または外傷性の脳障害、各種神経変性によって起こる脳神経細胞障害を抑制し、脳卒中、外傷性脳疾患、脳浮腫、脳神経変性疾患などの各種脳疾患の治療・予防、その後遺症の改善、また再発予防に用いる薬剤として有用である。

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード (参考情報)

AL	アルバニア	FI	フィンランド	LT	リトアニア	SN	セネガル
AM	アルメニア	FR	フランス	LU	ルクセンブルグ	SZ	スワジランド
AT	オーストリア	GB	英国	LV	ラトヴィア	TD	チャード
AU	オーストラリア	GE	グルジア	MC	モナコ	TG	トーゴ
AZ	アゼルバイジャン	GR	ギリシャ	MD	モルドヴァ	TJ	タジキスタン
BA	ボスニア・ヘルツェゴビナ	CH	スイス	MG	マダガスカル	TM	トルクメニスタン
BB	バルバドス	CN	中国	MK	マケドニア共和国	TR	トルコ
BE	ベルギー	DE	ドイツ	ML	マリ	TT	トリニダード・トバゴ
BG	ブルガリア	DK	デンマーク	MN	モンゴル	UA	ウクライナ
BJ	ベナン	EE	エストニア	MR	モーリタニア	UG	ウガンダ
BR	ブラジル	EG	エジプト	MW	マラウイ	US	米国
BY	ベラルーシ	ES	スペイン	MX	メキシコ	UZ	ウズベキスタン
CA	カナダ	FI	フィンランド	NE	ニジェール	VN	ベトナム
CF	中央アフリカ共和国	FR	フランス	NL	オランダ	YU	ユーゴスラビア
CG	コンゴ共和国	GB	英国	NO	ノルウェー	ZW	ジンバブエ
CH	スイス	GE	グルジア	NZ	ニュージーランド		
CI	コートジボワール	GR	ギリシャ	PL	ポーランド		
CM	カメルーン	DE	ドイツ	PT	ポルトガル		
CN	中国	DK	デンマーク	RO	ルーマニア		
CU	キューバ	EE	エストニア	RU	ロシア		
CY	キプロス	EG	エジプト	SD	スーダン		
CZ	チェコ	ES	スペイン	SG	シンガポール		
DE	ドイツ	FI	フィンランド	SI	スロベニア		
DK	デンマーク	FR	フランス	SK	スロバキア		
EE	エストニア	GB	英国	SL	シエラレオネ		
ES	スペイン	GE	グルジア				

明細書

インドロモルヒナン誘導体および脳障害治療・予防剤

技術分野

本発明は、インドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩、およびそれらからなる脳障害治療・予防剤に関するものであり、各種脳疾患およびその後遺症の改善、再発予防に有用な医薬品に関する。

背景技術

近年、高齢化社会の到来に伴い、諸種脳血管障害など脳領域における疾患が増加している。脳血管障害は、加齢、高血圧、動脈硬化、高脂血症などが原因となって発症するものと考えられており、一般に脳卒中と呼ばれている。広義には、頭部外傷などによる脳の機能的損傷なども脳血管障害に含めて考えることができる。

脳卒中は大きく虚血性（梗塞性）疾患と出血性疾患とに分類され、具体的には前者として脳梗塞（脳血栓、脳塞栓）、後者として脳出血、クモ膜下出血などが挙げられる。これらの疾患では、いずれも脳血管の障害によって血流が途絶え、脳神経細胞の活動エネルギー源であるグルコースや酸素などの供給が不足し、その結果様々な神経細胞障害が引き起こされるが、これらは根本的に障害部位およびその周辺の脳神経細胞が壊死することに起因している。こうした脳血管障害の結果、脳血管性痴呆に代表される種々の後遺症が出現し、現在医学的また社会的に深刻な問題となっている。

これまで日本において、こうした脳血管障害に対する治療剤として開発されてきた薬剤は、主に精神神経症状改善などの後遺症改善を目的とするものであり、脳への血流量を増加させて、虚血部位へグルコースや酸素などの供給を促すといったものがその中心的存在である。これらは、その作用機序の面から脳循環改善薬、脳代謝賦活薬、脳機能改善薬といった曖昧な表現で呼ばれている。しかし、こうした薬剤のほとんどは、意欲障害、感情障害、行動異常などの周辺症状の改

善には有効とされている一方、記憶障害などの痴呆の中核症状に対してはその有効性が疑問視されている。また臨床的に、一部の抗脳浮腫薬、抗血栓薬、血栓溶解薬などが特に脳血管障害の急性期において使用されているが、これらも脳神経細胞に対して直接作用するものではなく、対症療法的に使用されているに過ぎない。いずれにしても、現存する上記薬剤は、脳血管障害時における脳神経細胞が受ける障害に対する効果がほとんどなく、脳神経細胞の壊死を直接抑制しようとするものではない。

以上のように、現在こうした脳血管障害の根本原因である脳神経細胞障害に対して有効な薬剤は皆無に等しい。この障害の程度は、脳血流の途絶えた虚血時間と相関し、虚血時間が長くに及ぶと器質的な障害をもたらす、もはや血流の回復によってもこの脳神経細胞障害は改善されることはないことが知られている。このように脳血管障害においては、特に発症からの24時間以内の急性期の治療が重要と考えられており、脳神経細胞障害に対する確実な保護効果があり、安全かつ使用しやすい薬剤の開発が早急に望まれている現状である。

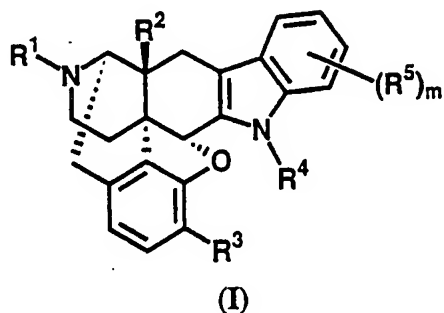
また、こうした脳血管障害とならんで、Alzheimer 病に代表される脳神経変性脳疾患の増加も問題となっており、その原因解明と治療法開発に向けた多方面からのアプローチが盛んに行われている。その主流は、特にアセチルコリン神経系の賦活をターゲットとしたものであるが、こうした脳神経変性疾患で生じる神経細胞壊死に対して、神経成長因子や神経栄養因子の関連物質などによる神経保護的作用によるアプローチも行われており、脳神経細胞保護作用を有する薬剤による効果も期待されている。

本発明は、脳障害治療・予防剤に関するものであり、各種脳疾患およびその後遺症の改善、再発予防に有用な医薬品を提供することを目的とする。さらに詳しくは、本発明は様々な虚血性、出血性、または外傷性の脳障害、各種神経変性によって起こる脳神経細胞障害を抑制することによって脳神経細胞を保護し、脳卒中、外傷性脳疾患、脳浮腫、脳神経変性疾患を治療・予防するのに有用な薬剤を提供するものである。

発明の開示

前記の目的は以下の本発明により達成される。

すなわち、本発明は一般式 (I)



〔式中、 R^1 は、水素、炭素数1～5のアルキル、炭素数4～7のシクロアルキルアルキル、炭素数5～7のシクロアルケニルアルキル、炭素数6～12のアリール、炭素数7～13のアラルキル、炭素数2～7のアルケニル、フラン-2-イルアルキル（ただし、アルキル部分の炭素数は1～5である）、またはチオフェン-2-イルアルキル（ただし、アルキル部分の炭素数は1～5である）を表し、

R^2 および R^3 は、独立して水素、ヒドロキシ、炭素数1～5のアルコキシ、炭素数1～5のアルカノイルオキシ、炭素数7～13のアラルキルオキシ、または炭素数7～13のアリールカルボニルオキシを表し、

R^4 は、水素、炭素数1～8のアルキル、炭素数7～13のアラルキル（ただし、1種以上の置換基 R^{15} により置換されていてもよい）、または R^6 を表し、

R^6 は、炭素数1～5のアルカノイル、炭素数7～13のアリールカルボニル（ただし、1種以上の置換基 R^{15} により置換されていてもよい）、炭素数1～5のアルキルスルホニル、炭素数6～12のアリールスルホニル（ただし、1種以上の置換基 R^{15} により置換されていてもよい）、炭素数7～13のアラルキルスルホニル（ただし、1種以上の置換基 R^{15} により置換されていてもよい）、または $(CH_2)_1-R^{16}$ を表し、

R^{16} は、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、炭

炭素数 1～5 のアルキル、炭素数 1～5 のアルコキシ、イソチオシアナト、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、またはシアノを表し、

i は、1～8 の整数を表し、

R^{16} は、 OR^7 、 $NR^7R^{7'}$ 、ニトロ、シアノ、イソシアノ、イソシアナト、イソチオシアナト、 $COOR^7$ 、 $CONR^7R^{7'}$ 、 NR^7CHO 、 $NR^7(CO)-R^9$ 、 $NR^7(CO)NR^8R^9$ 、 $NR^7(C=S)NR^8R^9$ 、 $NR^7(CO)O-R^9$ 、または $NR^7(C=S)O-R^9$ を表し（ここで、 R^7 、 $R^{7'}$ 、 R^8 はそれぞれ別個に水素または炭素数 1～5 のアルキルを表し、

R^9 は、炭素数 1～5 のアルキル、炭素数 6～12 のアリール（ただし、1 種以上の置換基 R^{15} により置換されていてもよい）、ヘテロ原子数 1～3 で炭素数 3～11 のヘテロアリール（ただし、ヘテロ原子とは O、N、または S であり、1 種以上の置換基 R^{15} により置換されていてもよい）、炭素数 7～13 のアラルキル（ただし、1 種以上の置換基 R^{15} により置換されていてもよい）、炭素数 8～15 のアリールアルケニル（ただし、アリール部分が 1 種以上の置換基 R^{15} により置換されていてもよい）を表し、

m は 0～4 の整数を表し、

R^6 はベンゼン環上の m 個の置換基であり、それぞれ別個にフルオロ、クロロ、ブロモ、アミノ、炭素数 1～8 のアルキル、炭素数 3～7 のシクロアルキル、炭素数 1～5 のアルコキシを表し（ただし、 R^4 が R^6 である場合には、 R^5 は R^{11} を表す）、または隣接する炭素にそれぞれ置換する 2 個の R^6 が一緒になって縮合環構造 A を表し（ただし、残る 0～2 個の R^5 は別個に R^{11} を表すかまたはもう 1 組の縮合環構造 A を表す）、

縮合環構造 A は、0～4 個の置換基 R^{10} で置換されたベンゾ、インデノ、またはナフトを表し、

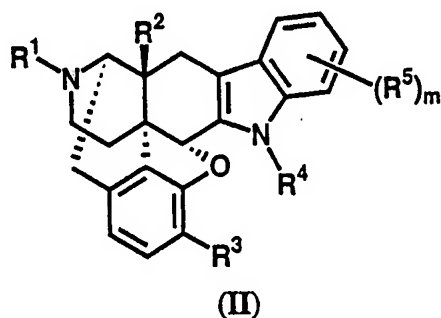
R^{10} および R^{11} は、①それぞれ別個にフルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ニトロ、炭素数 1～8 のアルキル、炭素数 1～5 のアルコキシ、イソチオシアナト、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、フェニル、炭素数 1～3 のヒドロキシアルキル、 SR^{12} 、 SOR^{12} 、 SO_2R^{12} 、 $(CH_2)_kCO_2R^{12}$ 、 $SO_2NR^{13}R^{14}$ 、 $CONR^{13}R^{14}$ 、 $(CH_2)_kNR^{13}R^{14}$ 、または $(CH_2)_kN$

(R^{13}) COR^{14} (ここで、 k は0～5の整数を表し、 R^{12} は炭素数1～5のアルキルを表し、 R^{13} および R^{14} はそれぞれ別個に水素、炭素数1～5のアルキル、炭素数4～6のシクロアルキルアルキルを表す)を表し、および/または②環縮合部をはさんで隣接する炭素にそれぞれ置換する R^{10} と R^{11} とが一緒になって $R^{10}-R^{11}$ となりエタノ、プロパノ、または α -ベンゼノのいずれかの架橋構造を表し、

一般式(I)は、(+)体、(-)体、(±)体を含む]

で示されるインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩からなる脳障害治療・予防剤に関する。

また、本発明は一般式(II)



[式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^{16} 、 i 、 R^6 、 R^{16} 、 R^7 、 R^{17} 、 R^8 、 R^9 、 m 、 R^5 、 A 、 R^{10} 、 R^{11} 、 k 、 R^{12} 、 R^{13} 、および R^{14} は前記定義に同じ(ただし、 R^4 が水素、炭素数1～8のアルキル、または炭素数7～13のアラルキルの場合には、 m が2～4の整数であり、2個の R^5 が縮合環構造Aであり、残る0～2個の R^5 が別個に R^{11} (ただし、この縮合環構造Aがベンゾの場合には、少なくとも1個の R^{10} と1個の R^{11} とが環縮合部をはさんで隣接する炭素にそれぞれ置換して一緒になった架橋構造 $R^{10}-R^{11}$ となりエタノ、プロパノ、または α -ベンゼノのいずれかでなくてはならない) またはもう1組の縮合環構造Aでなくてはならない)であり、一般式(II)は、(+)体、(-)体、(±)体を含む]で表されるインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩に関する。

発明を実施するための最良の形態

本発明の一般式 (I) で示されるインドロモルヒナン誘導体またはその薬理的に許容される酸付加塩からなる脳障害治療・予防剤のなかで、好ましい実施形態は以下の通りである。

R^1 としては水素、炭素数1から5のアルキル、炭素数4から7のシクロアルキルメチル、炭素数5から7のシクロアルケニルメチル、フェニル、ナフチル、炭素数7から13のフェニルアルキル、炭素数2から7のアルケニル、炭素数1から5のフラン-2-イルアルキル（ただし、ここで示す炭素数は、フラン-2-イルアルキルのアルキル部分の炭素数を示す）、炭素数1から5のチオフェン-2-イルアルキル（ただし、ここで示す炭素数は、チオフェン-2-イルアルキルのアルキル部分の炭素数を示す）が好ましく、特に水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、ベンジル、フェネチル、アリル、2-ブテニル、3-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、フラン-2-イルメチル、チオフェン-2-イルメチルが好ましい。これらの中でも特に水素、メチル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、ベンジル、フェネチル、アリルが好ましい。

R^2 、 R^3 としては水素、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、アセトキシ、ベンジルオキシ、ベンゾイルオキシが好ましい。これらの中でも特に R^2 としてはヒドロキシ、メトキシ、アセトキシが、また特に R^3 としては水素、ヒドロキシ、メトキシがそれぞれ好ましい。

R^4 としては、水素、メチル、エチル、ブチル、ベンジル、フェネチル、3-フェニルプロピルなどのほか、 R^6 として好ましいアセチル、ベンゾイル、メタンスルホニル、ベンゼンスルホニル、ベンジルスルホニル、 $(CH_2)_2-R^{16}$ 、 $(CH_2)_3-R^{16}$ 、 $(CH_2)_4-R^{16}$ などを好ましいものとして挙げることができる。

これら R^4 のうち、 R^4 がベンジル、フェネチル、3-フェニルプロピル、ベンゾイル、ベンゼンスルホニル、ベンジルスルホニルの場合では、アリーール部分が置換基 R^{16} で置換されていてもよく、この場合の R^{16} としてはフルオロ、クロロ

、プロモ、ニトロ、アミノ、メチル、メトキシ、イソチオシアナト、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノから選ばれる同じあるいは異なる1～2個の置換基であることが好ましく、特にフルオロ、クロロ、プロモ、ニトロ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチルから選ばれる1個の置換基であることが好ましい。

また上記の場合の R^{16} としては、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、ニトロ、シアノ、イソシアノ、イソシアナト、イソチオシアナト、 COOH 、 COOMe 、 COOEt 、 CONH_2 、 NHCHO 、 $\text{NH}(\text{CO})-\text{R}^9$ 、 $\text{NH}(\text{CO})\text{NH}-\text{R}^9$ 、 $\text{NH}(\text{C}=\text{S})\text{NH}-\text{R}^9$ 、 $\text{NH}(\text{CO})\text{O}-\text{R}^9$ 、 $\text{NH}(\text{C}=\text{S})\text{O}-\text{R}^9$ が好ましく、これらの中でも特にヒドロキシ、メトキシ、アミノ、ニトロ、シアノ、イソチオシアナト、 COOH 、 COOMe 、 COOEt 、 NHCHO 、 $\text{NH}(\text{CO})-\text{R}^9$ 、 $\text{NH}(\text{CO})\text{NH}-\text{R}^9$ 、 $\text{NH}(\text{C}=\text{S})\text{NH}-\text{R}^9$ が好ましい。

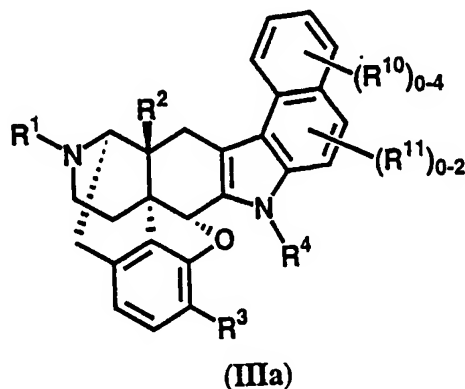
この場合の R^9 としては、メチル、フェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、ピリジル、インドリル、キノリル、ベンジル、シンナミルが好ましい。これら R^9 のうちメチルを除くものは、そのアリール部分が置換基 R^{15} で置換されていてもよく、この場合の R^{15} としてはフルオロ、クロロ、プロモ、ニトロ、アミノ、メチル、メトキシ、イソチオシアナト、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノから選ばれる同じあるいは異なる1～2個の置換基であることが好ましく、特にフルオロ、クロロ、プロモ、ニトロ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチルから選ばれる1個の置換基であることが好ましい。

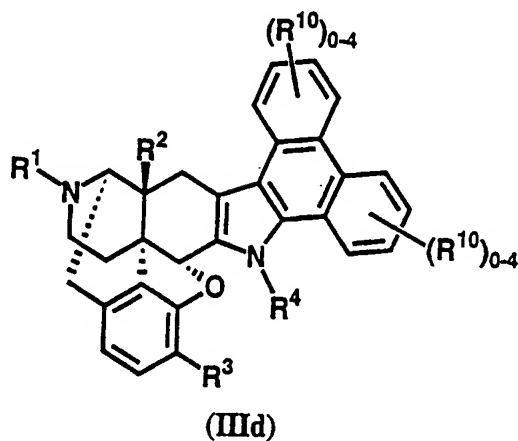
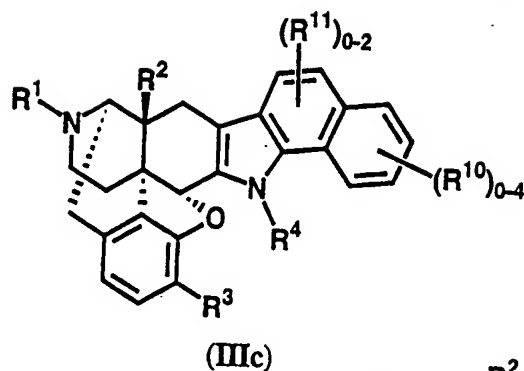
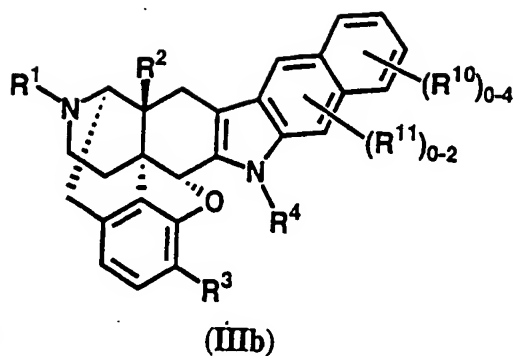
このように挙げられる R^4 のうち、特に好ましいものとして具体的には、水素、メチル、エチル、ブチル、ベンジル、フルオロベンジル、クロロベンジル、プロモベンジル、メチルベンジル、メトキシベンジル、ニトロベンジル、(トリフルオロメチル)ベンジル、2-フェネチル、3-フェニルプロピル、アセチル、ベンゾイル、メタンスルホンニル、ベンゼンスルホンニル、トルエンスルホンニル、ベンジルスルホンニル、 $(\text{CH}_2)_2\text{OH}$ 、 $(\text{CH}_2)_2\text{OMe}$ 、 $(\text{CH}_2)_2\text{OEt}$ 、 $(\text{CH}_2)_2\text{NH}_2$ 、 $(\text{CH}_2)_2\text{NO}_2$ 、 $(\text{CH}_2)_2\text{CN}$ 、 $(\text{CH}_2)_2\text{NCS}$ 、 $(\text{CH}_2)_2\text{COOH}$ 、 $(\text{CH}_2)_2\text{COOMe}$ 、 $(\text{CH}_2)_2\text{COOEt}$ 、 $(\text{CH}_2)_2\text{NHCH}$

O、 $(\text{CH}_2)_2\text{NH}(\text{CO})\text{Ph}$ 、 $(\text{CH}_2)_2\text{NH}(\text{CO})$ —シンナミル、 $(\text{CH}_2)_2\text{NH}(\text{CO})$ —(トリフルオロメチル)シンナミル、 $(\text{CH}_2)_2\text{NH}(\text{CO})$ —ピリジル、 $(\text{CH}_2)_2\text{NH}(\text{CO})\text{NHPh}$ 、 $(\text{CH}_2)_2\text{NH}(\text{C}=\text{S})\text{NHPh}$ 、 $(\text{CH}_2)_2\text{NH}(\text{C}=\text{S})\text{NHCH}_2\text{Ph}$ 、 $(\text{CH}_2)_3\text{OH}$ 、 $(\text{CH}_2)_3\text{OMe}$ 、 $(\text{CH}_2)_3\text{OEt}$ 、 $(\text{CH}_2)_3\text{NH}_2$ 、 $(\text{CH}_2)_3\text{NO}_2$ 、 $(\text{CH}_2)_3\text{CN}$ 、 $(\text{CH}_2)_3\text{NCS}$ 、 $(\text{CH}_2)_3\text{COOH}$ 、 $(\text{CH}_2)_3\text{COOMe}$ 、 $(\text{CH}_2)_3\text{COOEt}$ 、 $(\text{CH}_2)_3\text{NHCHO}$ 、 $(\text{CH}_2)_3\text{NH}(\text{CO})\text{Ph}$ 、 $(\text{CH}_2)_3\text{NH}(\text{CO})$ —シンナミル、 $(\text{CH}_2)_3\text{NH}(\text{CO})$ —(トリフルオロメチル)シンナミル、 $(\text{CH}_2)_3\text{NH}(\text{CO})$ —ピリジル、 $(\text{CH}_2)_3\text{NH}(\text{CO})\text{NHPh}$ 、 $(\text{CH}_2)_3\text{NH}(\text{C}=\text{S})\text{NHPh}$ 、 $(\text{CH}_2)_3\text{NH}(\text{C}=\text{S})\text{NHCH}_2\text{Ph}$ 、 $(\text{CH}_2)_4\text{OH}$ 、 $(\text{CH}_2)_4\text{OMe}$ 、 $(\text{CH}_2)_4\text{OEt}$ 、 $(\text{CH}_2)_4\text{NH}_2$ 、 $(\text{CH}_2)_4\text{NO}_2$ 、 $(\text{CH}_2)_4\text{CN}$ 、 $(\text{CH}_2)_4\text{NCS}$ 、 $(\text{CH}_2)_4\text{COOH}$ 、 $(\text{CH}_2)_4\text{COOMe}$ 、 $(\text{CH}_2)_4\text{COOEt}$ 、 $(\text{CH}_2)_4\text{NHCHO}$ 、 $(\text{CH}_2)_4\text{NH}(\text{CO})\text{Ph}$ 、 $(\text{CH}_2)_4\text{NH}(\text{CO})$ —シンナミル、 $(\text{CH}_2)_4\text{NH}(\text{CO})$ —(トリフルオロメチル)シンナミル、 $(\text{CH}_2)_4\text{NH}(\text{CO})$ —ピリジル、 $(\text{CH}_2)_4\text{NH}(\text{CO})\text{NHPh}$ 、 $(\text{CH}_2)_4\text{NH}(\text{C}=\text{S})\text{NHPh}$ 、 $(\text{CH}_2)_4\text{NH}(\text{C}=\text{S})\text{NHCH}_2\text{Ph}$ などが列挙されるが、これらに限定されるものではない。

R^5 としては、縮合環構造Aを形成しない場合にはフルオロ、クロロ、ブロモ、アミノ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ヘプチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、メトキシ、エトキシが好ましく、とりわけフルオロ、クロロ、ブロモ、メチル、ヘプチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、メトキシが好ましい。ただし、 R^4 が R^6 である場合には、 R^5 は R^{11} を表し、この場合の R^{11} としては、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ニトロ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ヘプチル、メトキシ、イソチオシアナト、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、フェニル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、 SR^{12} 、 SOR^{12} 、 SO_2R^{12} 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}^{12}$ 、 $(\text{CH}_2)_2\text{CO}_2\text{R}^{12}$ 、 $(\text{CH}_2)_3\text{CO}_2\text{R}^{12}$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ 、 $\text{CONR}^{13}\text{R}^{14}$ 、 $\text{CH}_2\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ 、 $(\text{CH}_2)_2\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ 、 $(\text{CH}_2)_3\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ 、 $\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{13})\text{COR}$

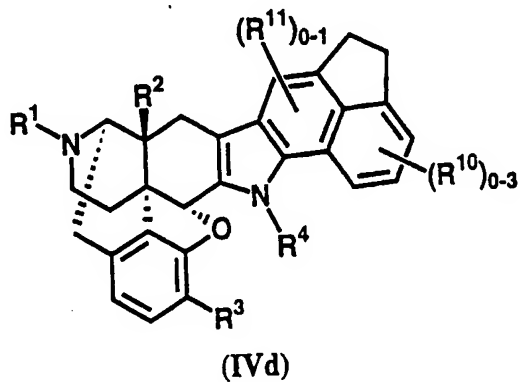
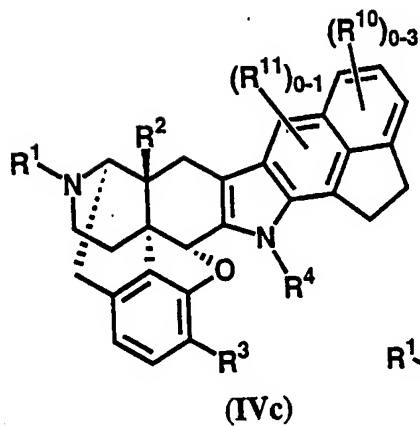
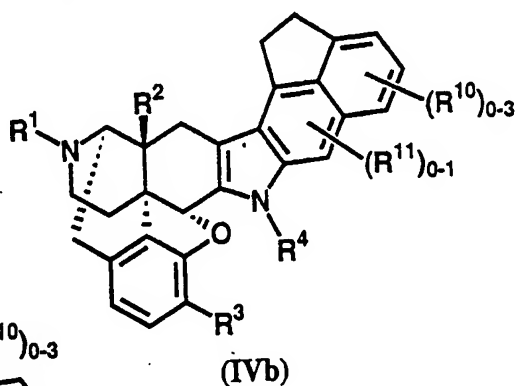
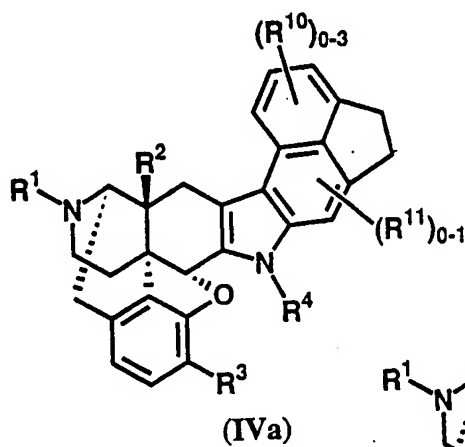
14 、 $(CH_2)_2N(R^{13})COR^{14}$ 、 $(CH_2)_3N(R^{13})COR^{14}$ が挙げられ、これらの中でもフルオロ、クロロ、ブロモ、ニトロ、メチル、エチル、ヘプチル、メトキシ、イソチオシアナト、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、フェニル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、 SR^{12} 、 SOR^{12} 、 SO_2R^{12} 、 $CH_2CO_2R^{12}$ 、 $(CH_2)_2CO_2R^{12}$ 、 $(CH_2)_3CO_2R^{12}$ 、 $SO_2NR^{13}R^{14}$ 、 $CONR^{13}R^{14}$ 、 $CH_2NR^{13}R^{14}$ 、 $(CH_2)_2NR^{13}R^{14}$ 、 $(CH_2)_3NR^{13}R^{14}$ 、 $CH_2N(R^{13})COR^{14}$ 、 $(CH_2)_2N(R^{13})COR^{14}$ 、 $(CH_2)_3N(R^{13})COR^{14}$ が好ましく、これらの場合の R^{12} としてはメチル、エチル、 R^{13} としては水素、メチル、 R^{14} としては水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチルがそれぞれ好ましい。また R^5 のうち、2個の R^6 が一緒になって縮合環構造Aを形成する場合には、残る0～2個の R^5 は R^{11} であるか、さらに2個の R^5 が一緒になって縮合環構造Aを形成するかのいずれかである。この縮合環構造Aとしては、0～2個の R^{10} で置換されたベンゾ、 R^{10} で置換されていないインデノまたはナフトが好ましく、特に0～1個の R^{10} で置換されたベンゾが好ましい。例えば、2個の R^5 が一緒になって1個の縮合環構造Aを形成し、この縮合環構造Aがベンゾである場合は、一般式(I)の化合物は、具体的には下記の一般式(IIIa)、(IIIb)、(IIIc)、(IIId)で例示されるが、これらは一般式(I)を限定するものではない。





R^{10} 、 R^{11} としては、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ニトロ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、メトキシ、イソチオシアナト、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、フェニル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、 SR^{12} 、 SOR^{12} 、 SO_2R^{12} 、 $CH_2CO_2R^{12}$ 、 $(CH_2)_2CO_2R^{12}$ 、 $(CH_2)_3CO_2R^{12}$ 、 $SO_2NR^{13}R^{14}$ 、 $CONR^{13}R^{14}$ 、 $CH_2NR^{13}R^{14}$ 、 $(CH_2)_2NR^{13}R^{14}$ 、 $(CH_2)_3NR^{13}R^{14}$ 、 $CH_2N(R^{13})COR^{14}$ 、 $(CH_2)_2N(R^{13})COR^{14}$ 、 $(CH_2)_3N(R^{13})COR^{14}$ が好ましく、この場合の R^{12} としてはメチル、エチル、 R^{13} としては水素、メチル、エチル、 R^{14} としては水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、シクロブ

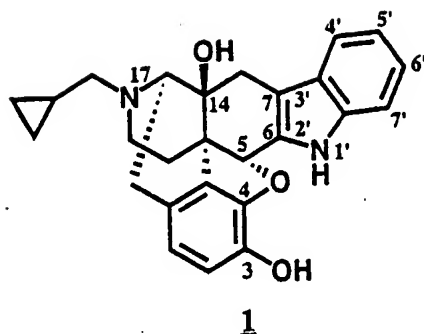
ロピルメチル、シクロブチルメチルがそれぞれ好ましい。また、 R^{10} と R^{11} と一緒になって $R^{10}-R^{11}$ となり架橋構造を形成してもよくこの場合には、この架橋構造としてはエタノ、 α -ベンゼノが好ましい。例えば、この架橋構造がエタノであり、かつ前記縮合環構造Aがベンゾである場合は、一般式(I)の化合物は、具体的には下記の一般式(IVa)、(IVb)、(IVc)、(IVd)で例示することができるが、これらは一般式(I)を特に限定するものではない。



本発明の一般式 (I I) で示されるインドロモルヒナン誘導体またはその薬理的に許容される酸付加塩のなかで、好ましい実施形態を与える置換基は、基本的には上記本発明の一般式 (I) で示されるインドロモルヒナン誘導体またはその薬理的に許容される酸付加塩からなる脳障害治療・予防剤のなかでの好ましい実施形態を与える置換基と同じ場合であるが、ただし、 R^4 が水素、炭素数 1～8 のアルキル、または炭素数 7～13 のアラルキルのいずれかの場合には、 m が 2～4 の整数となり、2 個の R^5 が縮合環構造 A を必ず形成し、残る 0～2 個の R^5 が別個に R^{11} となるか、またはもう 1 組の縮合環構造 A を形成しなくてはならない。この場合の縮合環構造 A としては、1～2 個の R^{10} で置換されたベンゾ、 R^{10} で置換されていないインデノまたはナフトが好ましい。このうち特に、この縮合環構造 A が 1～2 個の R^{10} で置換されたベンゾである場合には、さらに少なくともこの 1 個の R^{10} と 1 個の R^{11} とが環縮合部をはさんで隣接する炭素にそれぞれ置換して一緒になった架橋構造 $R^{10}-R^{11}$ となりエタノ、プロパノ、または α -ベンゼノのいずれかを必ず形成しなくてはならない。この場合の架橋構造 $R^{10}-R^{11}$ としてはエタノ、 α -ベンゼノが好ましい。

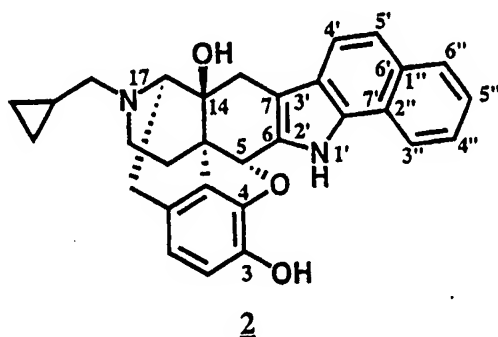
薬理的に好ましい酸付加塩としては、塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、リン酸塩等の無機酸塩、酢酸塩、乳酸塩、クエン酸塩、シュウ酸塩、グルタル酸塩、リンゴ酸塩、酒石酸塩、フマル酸塩、マンデル酸塩、マレイン酸塩、安息香酸塩、フタル酸塩等の有機カルボン酸塩、メタンスルホン酸塩、エタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、 p -トルエンスルホン酸塩、カンファースルホン酸塩等の有機スルホン酸塩等があげられ、中でも塩酸塩、リン酸塩、酒石酸塩、メタンスルホン酸塩等が好まれるが、もちろんこれに限られるものではない。

本発明の一般式 (I) の化合物のうち、 R^1 がシクロプロピルメチル、 R^2 、 R^3 がヒドロキシ、 R^4 が水素、 m が 0 である化合物 1



を、17-シクロプロピルメチル-3, 14 β -ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-インドロモルヒナンと命名する。

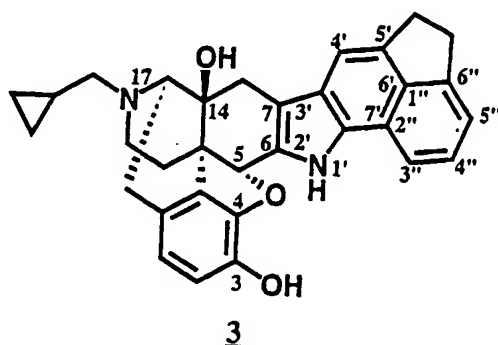
また、本発明の一般式 (I) の化合物のうち、R¹がシクロプロピルメチル、R²、R³がヒドロキシ、R⁴が水素、mが2で、2個のR⁵がインドール環6', 7'-位に置換して一緒になって縮合環構造Aを形成し、この縮合環構造Aがベンゾある化合物 2



を、17-シクロプロピルメチル-3, 14 β -ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナンと命名する。

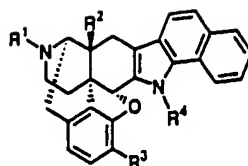
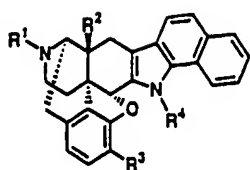
さらに、本発明の一般式 (I) の化合物のうち、R¹がシクロプロピルメチル、R²、R³がヒドロキシ、R⁴が水素、mが3で、2個のR⁵がインドール環6', 7'-位に置換して一緒になって縮合環構造Aを形成し、この縮合環構造Aが1

個の R^{10} で置換されたベンゾであり、残る1個の R^5 がインドール環5'-位に置換する R^{11} となり、 R^{11} と環縮合部をはさんで隣接するベンゼン環6''-位に置換する R^{10} とが一緒になって架橋構造 $R^{10}-R^{11}$ を形成し、この架橋構造がエタノである化合物3



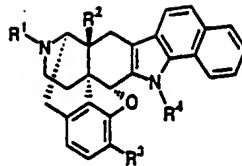
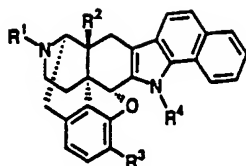
を、17-シクロプロピルメチル-3, 14 β -ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(5', 6''-エタノ-6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナンと命名する。

本発明の一般式(I)で示されるインドロモルヒナン誘導体としては、具体的には以下の一覧表に示す化合物が挙げられるが、これらは本発明を限定するものではない。



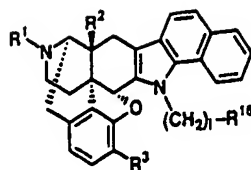
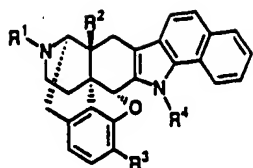
R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	H
cyclopropylmethyl	OH	OMe	H
cyclobutylmethyl	OH	OH	H
cyclobutylmethyl	OH	OMe	H
allyl	OH	OH	H
allyl	OH	OMe	H
H	OH	OH	H
H	OH	OMe	H
Me	OH	OH	H
Me	OH	OMe	H
benzyl	OH	OH	H
benzyl	OH	OMe	H
2-phenethyl	OH	OH	H
2-phenethyl	OH	OMe	H
cyclopropylmethyl	OH	OH	Me
cyclopropylmethyl	OH	OMe	Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	Me
cyclobutylmethyl	OH	OMe	Me
allyl	OH	OH	Me
allyl	OH	OMe	Me
H	OH	OH	Me
H	OH	OMe	Me
Me	OH	OH	Me
Me	OH	OMe	Me
benzyl	OH	OH	Me
benzyl	OH	OMe	Me
2-phenethyl	OH	OH	Me
2-phenethyl	OH	OMe	Me
cyclopropylmethyl	OH	OH	Et
cyclopropylmethyl	OH	OMe	Et
cyclobutylmethyl	OH	OH	Et
cyclobutylmethyl	OH	OMe	Et
allyl	OH	OH	Et
allyl	OH	OMe	Et
H	OH	OH	Et
H	OH	OMe	Et
Me	OH	OH	Et
Me	OH	OMe	Et
benzyl	OH	OH	Et
benzyl	OH	OMe	Et
2-phenethyl	OH	OH	Et
2-phenethyl	OH	OMe	Et
cyclopropylmethyl	OH	OH	Bu
cyclopropylmethyl	OH	OMe	Bu
cyclobutylmethyl	OH	OH	Bu
cyclobutylmethyl	OH	OMe	Bu
allyl	OH	OH	Bu
allyl	OH	OMe	Bu
H	OH	OH	Bu
H	OH	OMe	Bu
Me	OH	OH	Bu
Me	OH	OMe	Bu
benzyl	OH	OH	Bu
benzyl	OH	OMe	Bu
2-phenethyl	OH	OH	Bu
2-phenethyl	OH	OMe	Bu

R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhCH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	PhCH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhCH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	PhCH ₂
allyl	OH	OH	PhCH ₂
allyl	OH	OMe	PhCH ₂
H	OH	OH	PhCH ₂
H	OH	OMe	PhCH ₂
Me	OH	OH	PhCH ₂
Me	OH	OMe	PhCH ₂
benzyl	OH	OH	PhCH ₂
benzyl	OH	OMe	PhCH ₂
2-phenethyl	OH	OH	PhCH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	PhCH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OMe	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OMe	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OMe	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OMe	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OMe	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OMe	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OMe	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OMe	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OMe	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OMe	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OMe	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OMe	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂



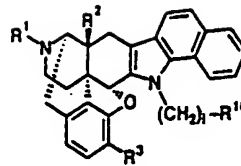
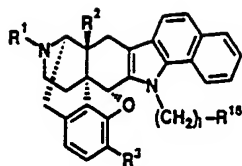
R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OMe	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OMe	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OMe	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OMe	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OMe	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OMe	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OMe	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OMe	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OMe	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OMe	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OMe	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OMe	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂

R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₂
allyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
allyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₂
H	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
H	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₂
Me	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
Me	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₂
benzyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
benzyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₂
2-phenethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
2-phenethyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
cyclopropylmethyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₃
cyclobutylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
cyclobutylmethyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₃
allyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
allyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₃
H	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
H	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₃
Me	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
Me	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₃
benzyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
benzyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₃
2-phenethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
2-phenethyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₃
cyclopropylmethyl	OH	OH	MeCO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	MeCO
cyclobutylmethyl	OH	OH	MeCO
cyclobutylmethyl	OH	OMe	MeCO
allyl	OH	OH	MeCO
allyl	OH	OMe	MeCO
H	OH	OH	MeCO
H	OH	OMe	MeCO
Me	OH	OH	MeCO
Me	OH	OMe	MeCO
benzyl	OH	OH	MeCO
benzyl	OH	OMe	MeCO
2-phenethyl	OH	OH	MeCO
2-phenethyl	OH	OMe	MeCO
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhCO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	PhCO
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhCO
cyclobutylmethyl	OH	OMe	PhCO
allyl	OH	OH	PhCO
allyl	OH	OMe	PhCO
H	OH	OH	PhCO
H	OH	OMe	PhCO
Me	OH	OH	PhCO
Me	OH	OMe	PhCO
benzyl	OH	OH	PhCO
benzyl	OH	OMe	PhCO
2-phenethyl	OH	OH	PhCO
2-phenethyl	OH	OMe	PhCO



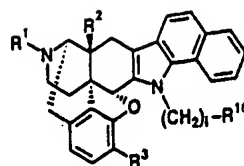
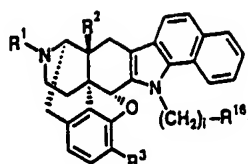
R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	MeSO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	MeSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	MeSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	MeSO ₂
allyl	OH	OH	MeSO ₂
allyl	OH	OMe	MeSO ₂
H	OH	OH	MeSO ₂
H	OH	OMe	MeSO ₂
Me	OH	OH	MeSO ₂
Me	OH	OMe	MeSO ₂
benzyl	OH	OH	MeSO ₂
benzyl	OH	OMe	MeSO ₂
2-phenethyl	OH	OH	MeSO ₂
2-phenethyl	OH	OMe	MeSO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhSO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	PhSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	PhSO ₂
allyl	OH	OH	PhSO ₂
allyl	OH	OMe	PhSO ₂
H	OH	OH	PhSO ₂
H	OH	OMe	PhSO ₂
Me	OH	OH	PhSO ₂
Me	OH	OMe	PhSO ₂
benzyl	OH	OH	PhSO ₂
benzyl	OH	OMe	PhSO ₂
2-phenethyl	OH	OH	PhSO ₂
2-phenethyl	OH	OMe	PhSO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
allyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
allyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
H	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
H	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
Me	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
Me	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
benzyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
benzyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhCH ₂ SO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	PhCH ₂ SO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhCH ₂ SO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	PhCH ₂ SO ₂
allyl	OH	OH	PhCH ₂ SO ₂
allyl	OH	OMe	PhCH ₂ SO ₂
H	OH	OH	PhCH ₂ SO ₂
H	OH	OMe	PhCH ₂ SO ₂
Me	OH	OH	PhCH ₂ SO ₂
Me	OH	OMe	PhCH ₂ SO ₂
benzyl	OH	OH	PhCH ₂ SO ₂
benzyl	OH	OMe	PhCH ₂ SO ₂
2-phenethyl	OH	OH	PhCH ₂ SO ₂
2-phenethyl	OH	OMe	PhCH ₂ SO ₂

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OH
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	OH
allyl	OH	OH	2	OH
allyl	OH	OMe	2	OH
H	OH	OH	2	OH
H	OH	OMe	2	OH
Me	OH	OH	2	OH
Me	OH	OMe	2	OH
benzyl	OH	OH	2	OH
benzyl	OH	OMe	2	OH
2-phenethyl	OH	OH	2	OH
2-phenethyl	OH	OMe	2	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	OMe
allyl	OH	OH	2	OMe
allyl	OH	OMe	2	OMe
H	OH	OH	2	OMe
H	OH	OMe	2	OMe
Me	OH	OH	2	OMe
Me	OH	OMe	2	OMe
benzyl	OH	OH	2	OMe
benzyl	OH	OMe	2	OMe
2-phenethyl	OH	OH	2	OMe
2-phenethyl	OH	OMe	2	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	OEt
allyl	OH	OH	2	OEt
allyl	OH	OMe	2	OEt
H	OH	OH	2	OEt
H	OH	OMe	2	OEt
Me	OH	OH	2	OEt
Me	OH	OMe	2	OEt
benzyl	OH	OH	2	OEt
benzyl	OH	OMe	2	OEt
2-phenethyl	OH	OH	2	OEt
2-phenethyl	OH	OMe	2	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NH ₂
allyl	OH	OH	2	NH ₂
allyl	OH	OMe	2	NH ₂
H	OH	OH	2	NH ₂
H	OH	OMe	2	NH ₂
Me	OH	OH	2	NH ₂
Me	OH	OMe	2	NH ₂
benzyl	OH	OH	2	NH ₂
benzyl	OH	OMe	2	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	2	NH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	2	NH ₂



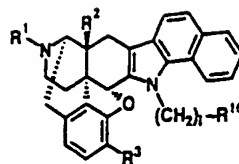
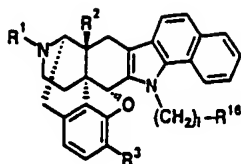
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NO ₂
allyl	OH	OH	2	NO ₂
allyl	OH	OMe	2	NO ₂
H	OH	OH	2	NO ₂
H	OH	OMe	2	NO ₂
Me	OH	OH	2	NO ₂
Me	OH	OMe	2	NO ₂
benzyl	OH	OH	2	NO ₂
benzyl	OH	OMe	2	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	2	NO ₂
2-phenethyl	OH	OMe	2	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	CN
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	CN
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	CN
allyl	OH	OH	2	CN
allyl	OH	OMe	2	CN
H	OH	OH	2	CN
H	OH	OMe	2	CN
Me	OH	OH	2	CN
Me	OH	OMe	2	CN
benzyl	OH	OH	2	CN
benzyl	OH	OMe	2	CN
2-phenethyl	OH	OH	2	CN
2-phenethyl	OH	OMe	2	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NCS
allyl	OH	OH	2	NCS
allyl	OH	OMe	2	NCS
H	OH	OH	2	NCS
H	OH	OMe	2	NCS
Me	OH	OH	2	NCS
Me	OH	OMe	2	NCS
benzyl	OH	OH	2	NCS
benzyl	OH	OMe	2	NCS
2-phenethyl	OH	OH	2	NCS
2-phenethyl	OH	OMe	2	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	COOH
allyl	OH	OH	2	COOH
allyl	OH	OMe	2	COOH
H	OH	OH	2	COOH
H	OH	OMe	2	COOH
Me	OH	OH	2	COOH
Me	OH	OMe	2	COOH
benzyl	OH	OH	2	COOH
benzyl	OH	OMe	2	COOH
2-phenethyl	OH	OH	2	COOH
2-phenethyl	OH	OMe	2	COOH

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	COOMe
allyl	OH	OH	2	COOMe
allyl	OH	OMe	2	COOMe
H	OH	OH	2	COOMe
H	OH	OMe	2	COOMe
Me	OH	OH	2	COOMe
Me	OH	OMe	2	COOMe
benzyl	OH	OH	2	COOMe
benzyl	OH	OMe	2	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	2	COOMe
2-phenethyl	OH	OMe	2	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	COOEt
allyl	OH	OH	2	COOEt
allyl	OH	OMe	2	COOEt
H	OH	OH	2	COOEt
H	OH	OMe	2	COOEt
Me	OH	OH	2	COOEt
Me	OH	OMe	2	COOEt
benzyl	OH	OH	2	COOEt
benzyl	OH	OMe	2	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	2	COOEt
2-phenethyl	OH	OMe	2	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCHO
allyl	OH	OH	2	NHCHO
allyl	OH	OMe	2	NHCHO
H	OH	OH	2	NHCHO
H	OH	OMe	2	NHCHO
Me	OH	OH	2	NHCHO
Me	OH	OMe	2	NHCHO
benzyl	OH	OH	2	NHCHO
benzyl	OH	OMe	2	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCHO
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-Me
allyl	OH	OH	2	NHCO-Me
allyl	OH	OMe	2	NHCO-Me
H	OH	OH	2	NHCO-Me
H	OH	OMe	2	NHCO-Me
Me	OH	OH	2	NHCO-Me
Me	OH	OMe	2	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	2	NHCO-Me
benzyl	OH	OMe	2	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCO-Me



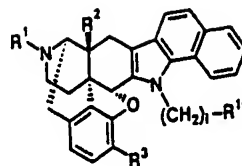
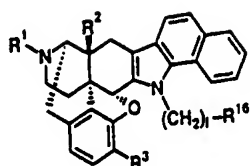
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
allyl	OH	OMe	2	NHCO-Ph
H	OH	OH	2	NHCO-Ph
H	OH	OMe	2	NHCO-Ph
Me	OH	OH	2	NHCO-Ph
Me	OH	OMe	2	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
benzyl	OH	OMe	2	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
allyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
allyl	OH	OMe	2	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
H	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
H	OH	OMe	2	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
Me	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
Me	OH	OMe	2	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
benzyl	OH	OMe	2	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OMe	2	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
H	OH	OMe	2	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OMe	2	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OMe	2	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OMe	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OMe	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OMe	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OMe	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OMe	2	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
H	OH	OMe	2	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
Me	OH	OMe	2	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OMe	2	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
allyl	OH	OMe	2	NHCO-NHPh
H	OH	OH	2	NHCO-NHPh
H	OH	OMe	2	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	2	NHCO-NHPh
Me	OH	OMe	2	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OMe	2	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
allyl	OH	OMe	2	NHCS-NHPh
H	OH	OH	2	NHCS-NHPh
H	OH	OMe	2	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	2	NHCS-NHPh
Me	OH	OMe	2	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OMe	2	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OMe	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OMe	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OMe	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OMe	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCS-NHCH ₂ Ph



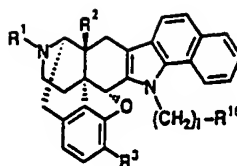
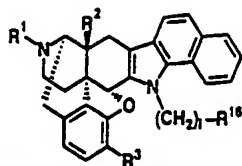
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OH
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	OH
allyl	OH	OH	3	OH
allyl	OH	OMe	3	OH
H	OH	OH	3	OH
H	OH	OMe	3	OH
Me	OH	OH	3	OH
Me	OH	OMe	3	OH
benzyl	OH	OH	3	OH
benzyl	OH	OMe	3	OH
2-phenethyl	OH	OH	3	OH
2-phenethyl	OH	OMe	3	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	OMe
allyl	OH	OH	3	OMe
allyl	OH	OMe	3	OMe
H	OH	OH	3	OMe
H	OH	OMe	3	OMe
Me	OH	OH	3	OMe
Me	OH	OMe	3	OMe
benzyl	OH	OH	3	OMe
benzyl	OH	OMe	3	OMe
2-phenethyl	OH	OH	3	OMe
2-phenethyl	OH	OMe	3	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OEi
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	OEi
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OEi
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	OEi
allyl	OH	OH	3	OEi
allyl	OH	OMe	3	OEi
H	OH	OH	3	OEi
H	OH	OMe	3	OEi
Me	OH	OH	3	OEi
Me	OH	OMe	3	OEi
benzyl	OH	OH	3	OEi
benzyl	OH	OMe	3	OEi
2-phenethyl	OH	OH	3	OEi
2-phenethyl	OH	OMe	3	OEi
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NH ₂
allyl	OH	OH	3	NH ₂
allyl	OH	OMe	3	NH ₂
H	OH	OH	3	NH ₂
H	OH	OMe	3	NH ₂
Me	OH	OH	3	NH ₂
Me	OH	OMe	3	NH ₂
benzyl	OH	OH	3	NH ₂
benzyl	OH	OMe	3	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	3	NH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	3	NH ₂

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NO ₂
allyl	OH	OH	3	NO ₂
allyl	OH	OMe	3	NO ₂
H	OH	OH	3	NO ₂
H	OH	OMe	3	NO ₂
Me	OH	OH	3	NO ₂
Me	OH	OMe	3	NO ₂
benzyl	OH	OH	3	NO ₂
benzyl	OH	OMe	3	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	3	NO ₂
2-phenethyl	OH	OMe	3	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	CN
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	CN
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	CN
allyl	OH	OH	3	CN
allyl	OH	OMe	3	CN
H	OH	OH	3	CN
H	OH	OMe	3	CN
Me	OH	OH	3	CN
Me	OH	OMe	3	CN
benzyl	OH	OH	3	CN
benzyl	OH	OMe	3	CN
2-phenethyl	OH	OH	3	CN
2-phenethyl	OH	OMe	3	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NCS
allyl	OH	OH	3	NCS
allyl	OH	OMe	3	NCS
H	OH	OH	3	NCS
H	OH	OMe	3	NCS
Me	OH	OH	3	NCS
Me	OH	OMe	3	NCS
benzyl	OH	OH	3	NCS
benzyl	OH	OMe	3	NCS
2-phenethyl	OH	OH	3	NCS
2-phenethyl	OH	OMe	3	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	COOH
allyl	OH	OH	3	COOH
allyl	OH	OMe	3	COOH
H	OH	OH	3	COOH
H	OH	OMe	3	COOH
Me	OH	OH	3	COOH
Me	OH	OMe	3	COOH
benzyl	OH	OH	3	COOH
benzyl	OH	OMe	3	COOH
2-phenethyl	OH	OH	3	COOH
2-phenethyl	OH	OMe	3	COOH



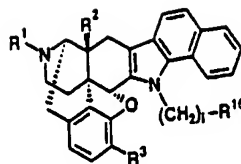
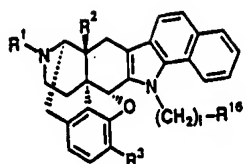
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	COOMe
allyl	OH	OH	3	COOMe
allyl	OH	OMe	3	COOMe
H	OH	OH	3	COOMe
H	OH	OMe	3	COOMe
Me	OH	OH	3	COOMe
Me	OH	OMe	3	COOMe
benzyl	OH	OH	3	COOMe
benzyl	OH	OMe	3	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	3	COOMe
2-phenethyl	OH	OMe	3	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	COOEt
allyl	OH	OH	3	COOEt
allyl	OH	OMe	3	COOEt
H	OH	OH	3	COOEt
H	OH	OMe	3	COOEt
Me	OH	OH	3	COOEt
Me	OH	OMe	3	COOEt
benzyl	OH	OH	3	COOEt
benzyl	OH	OMe	3	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	3	COOEt
2-phenethyl	OH	OMe	3	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCHO
allyl	OH	OH	3	NHCHO
allyl	OH	OMe	3	NHCHO
H	OH	OH	3	NHCHO
H	OH	OMe	3	NHCHO
Me	OH	OH	3	NHCHO
Me	OH	OMe	3	NHCHO
benzyl	OH	OH	3	NHCHO
benzyl	OH	OMe	3	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCHO
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Me
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-Me
allyl	OH	OH	3	NHCO-Me
allyl	OH	OMe	3	NHCO-Me
H	OH	OH	3	NHCO-Me
H	OH	OMe	3	NHCO-Me
Me	OH	OH	3	NHCO-Me
Me	OH	OMe	3	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	3	NHCO-Me
benzyl	OH	OMe	3	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCO-Me

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
allyl	OH	OMe	3	NHCO-Ph
H	OH	OH	3	NHCO-Ph
H	OH	OMe	3	NHCO-Ph
Me	OH	OH	3	NHCO-Ph
Me	OH	OMe	3	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
benzyl	OH	OMe	3	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
allyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
allyl	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
H	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
H	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
Me	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
Me	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
benzyl	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₅ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OMe	3	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
H	OH	OMe	3	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OMe	3	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OMe	3	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)



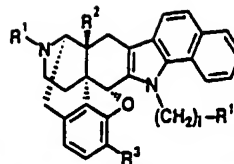
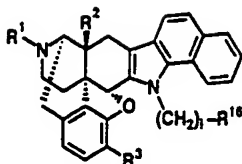
R ¹	R ²	R ³	i	R ¹⁸
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
H	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
Me	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
allyl	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
H	OH	OH	3	NHCO-NHPh
H	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	3	NHCO-NHPh
Me	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
allyl	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
H	OH	OH	3	NHCS-NHPh
H	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	3	NHCS-NHPh
Me	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OMe	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OMe	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OMe	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OMe	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHCH ₂ Ph

R ¹	R ²	R ³	i	R ¹⁸
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OH
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	OH
allyl	OH	OH	4	OH
allyl	OH	OMe	4	OH
H	OH	OH	4	OH
H	OH	OMe	4	OH
Me	OH	OH	4	OH
Me	OH	OMe	4	OH
benzyl	OH	OH	4	OH
benzyl	OH	OMe	4	OH
2-phenethyl	OH	OH	4	OH
2-phenethyl	OH	OMe	4	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	OMe
allyl	OH	OH	4	OMe
allyl	OH	OMe	4	OMe
H	OH	OH	4	OMe
H	OH	OMe	4	OMe
Me	OH	OH	4	OMe
Me	OH	OMe	4	OMe
benzyl	OH	OH	4	OMe
benzyl	OH	OMe	4	OMe
2-phenethyl	OH	OH	4	OMe
2-phenethyl	OH	OMe	4	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	OEt
allyl	OH	OH	4	OEt
allyl	OH	OMe	4	OEt
H	OH	OH	4	OEt
H	OH	OMe	4	OEt
Me	OH	OH	4	OEt
Me	OH	OMe	4	OEt
benzyl	OH	OH	4	OEt
benzyl	OH	OMe	4	OEt
2-phenethyl	OH	OH	4	OEt
2-phenethyl	OH	OMe	4	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NH ₂
allyl	OH	OH	4	NH ₂
allyl	OH	OMe	4	NH ₂
H	OH	OH	4	NH ₂
H	OH	OMe	4	NH ₂
Me	OH	OH	4	NH ₂
Me	OH	OMe	4	NH ₂
benzyl	OH	OH	4	NH ₂
benzyl	OH	OMe	4	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	4	NH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	4	NH ₂



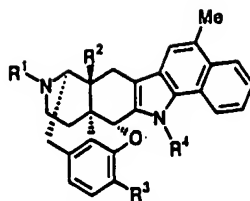
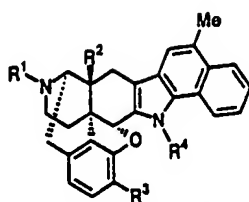
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NO ₂
allyl	OH	OH	4	NO ₂
allyl	OH	OMe	4	NO ₂
H	OH	OH	4	NO ₂
H	OH	OMe	4	NO ₂
Me	OH	OH	4	NO ₂
Me	OH	OMe	4	NO ₂
benzyl	OH	OH	4	NO ₂
benzyl	OH	OMe	4	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	4	NO ₂
2-phenethyl	OH	OMe	4	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	CN
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	CN
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	CN
allyl	OH	OH	4	CN
allyl	OH	OMe	4	CN
H	OH	OH	4	CN
H	OH	OMe	4	CN
Me	OH	OH	4	CN
Me	OH	OMe	4	CN
benzyl	OH	OH	4	CN
benzyl	OH	OMe	4	CN
2-phenethyl	OH	OH	4	CN
2-phenethyl	OH	OMe	4	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NCS
allyl	OH	OH	4	NCS
allyl	OH	OMe	4	NCS
H	OH	OH	4	NCS
H	OH	OMe	4	NCS
Me	OH	OH	4	NCS
Me	OH	OMe	4	NCS
benzyl	OH	OH	4	NCS
benzyl	OH	OMe	4	NCS
2-phenethyl	OH	OH	4	NCS
2-phenethyl	OH	OMe	4	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	COOH
allyl	OH	OH	4	COOH
allyl	OH	OMe	4	COOH
H	OH	OH	4	COOH
H	OH	OMe	4	COOH
Me	OH	OH	4	COOH
Me	OH	OMe	4	COOH
benzyl	OH	OH	4	COOH
benzyl	OH	OMe	4	COOH
2-phenethyl	OH	OH	4	COOH
2-phenethyl	OH	OMe	4	COOH

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	COOMe
allyl	OH	OH	4	COOMe
allyl	OH	OMe	4	COOMe
H	OH	OH	4	COOMe
H	OH	OMe	4	COOMe
Me	OH	OH	4	COOMe
Me	OH	OMe	4	COOMe
benzyl	OH	OH	4	COOMe
benzyl	OH	OMe	4	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	4	COOMe
2-phenethyl	OH	OMe	4	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	COOEt
allyl	OH	OH	4	COOEt
allyl	OH	OMe	4	COOEt
H	OH	OH	4	COOEt
H	OH	OMe	4	COOEt
Me	OH	OH	4	COOEt
Me	OH	OMe	4	COOEt
benzyl	OH	OH	4	COOEt
benzyl	OH	OMe	4	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	4	COOEt
2-phenethyl	OH	OMe	4	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCHO
allyl	OH	OH	4	NHCHO
allyl	OH	OMe	4	NHCHO
H	OH	OH	4	NHCHO
H	OH	OMe	4	NHCHO
Me	OH	OH	4	NHCHO
Me	OH	OMe	4	NHCHO
benzyl	OH	OH	4	NHCHO
benzyl	OH	OMe	4	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCHO
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-Me
allyl	OH	OH	4	NHCO-Me
allyl	OH	OMe	4	NHCO-Me
H	OH	OH	4	NHCO-Me
H	OH	OMe	4	NHCO-Me
Me	OH	OH	4	NHCO-Me
Me	OH	OMe	4	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	4	NHCO-Me
benzyl	OH	OMe	4	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCO-Me



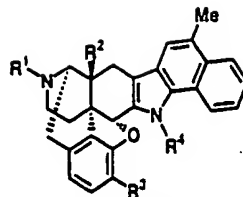
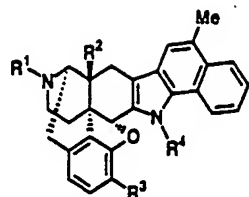
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
allyl	OH	OMe	4	NHCO-Ph
H	OH	OH	4	NHCO-Ph
H	OH	OMe	4	NHCO-Ph
Me	OH	OH	4	NHCO-Ph
Me	OH	OMe	4	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
benzyl	OH	OMe	4	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OMe	4	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
H	OH	OMe	4	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OMe	4	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OMe	4	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
H	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
Me	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
allyl	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
H	OH	OH	4	NHCO-NHPh
H	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	4	NHCO-NHPh
Me	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
allyl	OH	OMe	4	NHCS-NHPh
H	OH	OH	4	NHCS-NHPh
H	OH	OMe	4	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	4	NHCS-NHPh
Me	OH	OMe	4	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OMe	4	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OMe	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OMe	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OMe	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OMe	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHCH ₂ Ph



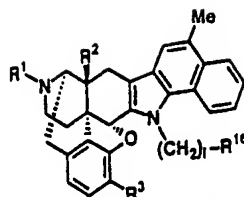
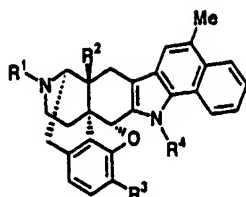
R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	H
cyclopropylmethyl	OH	OMe	H
cyclobutylmethyl	OH	OH	H
cyclobutylmethyl	OH	OMe	H
allyl	OH	OH	H
allyl	OH	OMe	H
H	OH	OH	H
H	OH	OMe	H
Me	OH	OH	H
Me	OH	OMe	H
benzyl	OH	OH	H
benzyl	OH	OMe	H
2-phenethyl	OH	OH	H
2-phenethyl	OH	OMe	H
cyclopropylmethyl	OH	OH	Me
cyclopropylmethyl	OH	OMe	Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	Me
cyclobutylmethyl	OH	OMe	Me
allyl	OH	OH	Me
allyl	OH	OMe	Me
H	OH	OH	Me
H	OH	OMe	Me
Me	OH	OH	Me
Me	OH	OMe	Me
benzyl	OH	OH	Me
benzyl	OH	OMe	Me
2-phenethyl	OH	OH	Me
2-phenethyl	OH	OMe	Me
cyclopropylmethyl	OH	OH	Et
cyclopropylmethyl	OH	OMe	Et
cyclobutylmethyl	OH	OH	Et
cyclobutylmethyl	OH	OMe	Et
allyl	OH	OH	Et
allyl	OH	OMe	Et
H	OH	OH	Et
H	OH	OMe	Et
Me	OH	OH	Et
Me	OH	OMe	Et
benzyl	OH	OH	Et
benzyl	OH	OMe	Et
2-phenethyl	OH	OH	Et
2-phenethyl	OH	OMe	Et
cyclopropylmethyl	OH	OH	Bu
cyclopropylmethyl	OH	OMe	Bu
cyclobutylmethyl	OH	OH	Bu
cyclobutylmethyl	OH	OMe	Bu
allyl	OH	OH	Bu
allyl	OH	OMe	Bu
H	OH	OH	Bu
H	OH	OMe	Bu
Me	OH	OH	Bu
Me	OH	OMe	Bu
benzyl	OH	OH	Bu
benzyl	OH	OMe	Bu
2-phenethyl	OH	OH	Bu
2-phenethyl	OH	OMe	Bu

R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhCH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	PhCH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhCH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	PhCH ₂
allyl	OH	OH	PhCH ₂
allyl	OH	OMe	PhCH ₂
H	OH	OH	PhCH ₂
H	OH	OMe	PhCH ₂
Me	OH	OH	PhCH ₂
Me	OH	OMe	PhCH ₂
benzyl	OH	OH	PhCH ₂
benzyl	OH	OMe	PhCH ₂
2-phenethyl	OH	OH	PhCH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	PhCH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OMe	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OMe	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OMe	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OMe	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OMe	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OMe	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OMe	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OMe	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OMe	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OMe	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OMe	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OMe	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂



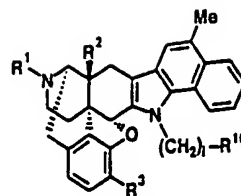
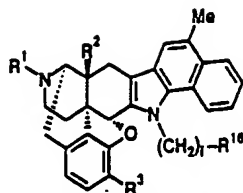
R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OMe	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OMe	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OMe	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OMe	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OMe	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OMe	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OMe	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OMe	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OMe	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OMe	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OMe	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OMe	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂

R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₂
allyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
allyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₂
H	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
H	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₂
Me	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
Me	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₂
benzyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
benzyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₂
2-phenethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
2-phenethyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
cyclopropylmethyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₃
cyclobutylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
cyclobutylmethyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₃
allyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
allyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₃
H	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
H	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₃
Me	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
Me	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₃
benzyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
benzyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₃
2-phenethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
2-phenethyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₃
cyclopropylmethyl	OH	OH	MeCO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	MeCO
cyclobutylmethyl	OH	OH	MeCO
cyclobutylmethyl	OH	OMe	MeCO
allyl	OH	OH	MeCO
allyl	OH	OMe	MeCO
H	OH	OH	MeCO
H	OH	OMe	MeCO
Me	OH	OH	MeCO
Me	OH	OMe	MeCO
benzyl	OH	OH	MeCO
benzyl	OH	OMe	MeCO
2-phenethyl	OH	OH	MeCO
2-phenethyl	OH	OMe	MeCO
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhCO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	PhCO
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhCO
cyclobutylmethyl	OH	OMe	PhCO
allyl	OH	OH	PhCO
allyl	OH	OMe	PhCO
H	OH	OH	PhCO
H	OH	OMe	PhCO
Me	OH	OH	PhCO
Me	OH	OMe	PhCO
benzyl	OH	OH	PhCO
benzyl	OH	OMe	PhCO
2-phenethyl	OH	OH	PhCO
2-phenethyl	OH	OMe	PhCO



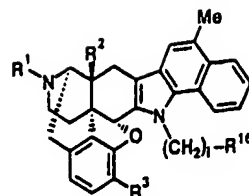
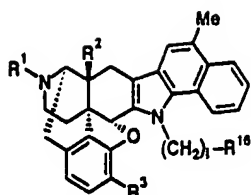
R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	MeSO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	MeSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	MeSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	MeSO ₂
allyl	OH	OH	MeSO ₂
allyl	OH	OMe	MeSO ₂
H	OH	OH	MeSO ₂
H	OH	OMe	MeSO ₂
Me	OH	OH	MeSO ₂
Me	OH	OMe	MeSO ₂
benzyl	OH	OH	MeSO ₂
benzyl	OH	OMe	MeSO ₂
2-phenethyl	OH	OH	MeSO ₂
2-phenethyl	OH	OMe	MeSO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhSO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	PhSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	PhSO ₂
allyl	OH	OH	PhSO ₂
allyl	OH	OMe	PhSO ₂
H	OH	OH	PhSO ₂
H	OH	OMe	PhSO ₂
Me	OH	OH	PhSO ₂
Me	OH	OMe	PhSO ₂
benzyl	OH	OH	PhSO ₂
benzyl	OH	OMe	PhSO ₂
2-phenethyl	OH	OH	PhSO ₂
2-phenethyl	OH	OMe	PhSO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
allyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
allyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
H	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
H	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
Me	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
Me	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
benzyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
benzyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhCH ₂ SO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	PhCH ₂ SO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhCH ₂ SO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	PhCH ₂ SO ₂
allyl	OH	OH	PhCH ₂ SO ₂
allyl	OH	OMe	PhCH ₂ SO ₂
H	OH	OH	PhCH ₂ SO ₂
H	OH	OMe	PhCH ₂ SO ₂
Me	OH	OH	PhCH ₂ SO ₂
Me	OH	OMe	PhCH ₂ SO ₂
benzyl	OH	OH	PhCH ₂ SO ₂
benzyl	OH	OMe	PhCH ₂ SO ₂
2-phenethyl	OH	OH	PhCH ₂ SO ₂
2-phenethyl	OH	OMe	PhCH ₂ SO ₂

R ¹	R ²	R ³	I	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OH
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	OH
allyl	OH	OH	2	OH
allyl	OH	OMe	2	OH
H	OH	OH	2	OH
H	OH	OMe	2	OH
Me	OH	OH	2	OH
Me	OH	OMe	2	OH
benzyl	OH	OH	2	OH
benzyl	OH	OMe	2	OH
2-phenethyl	OH	OH	2	OH
2-phenethyl	OH	OMe	2	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	OMe
allyl	OH	OH	2	OMe
allyl	OH	OMe	2	OMe
H	OH	OH	2	OMe
H	OH	OMe	2	OMe
Me	OH	OH	2	OMe
Me	OH	OMe	2	OMe
benzyl	OH	OH	2	OMe
benzyl	OH	OMe	2	OMe
2-phenethyl	OH	OH	2	OMe
2-phenethyl	OH	OMe	2	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	OEt
allyl	OH	OH	2	OEt
allyl	OH	OMe	2	OEt
H	OH	OH	2	OEt
H	OH	OMe	2	OEt
Me	OH	OH	2	OEt
Me	OH	OMe	2	OEt
benzyl	OH	OH	2	OEt
benzyl	OH	OMe	2	OEt
2-phenethyl	OH	OH	2	OEt
2-phenethyl	OH	OMe	2	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NH ₂
allyl	OH	OH	2	NH ₂
allyl	OH	OMe	2	NH ₂
H	OH	OH	2	NH ₂
H	OH	OMe	2	NH ₂
Me	OH	OH	2	NH ₂
Me	OH	OMe	2	NH ₂
benzyl	OH	OH	2	NH ₂
benzyl	OH	OMe	2	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	2	NH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	2	NH ₂



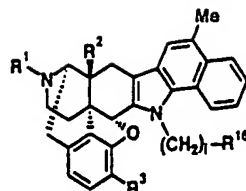
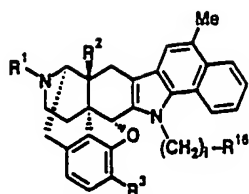
R ¹	R ²	R ³	i	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NO ₂
allyl	OH	OH	2	NO ₂
allyl	OH	OMe	2	NO ₂
H	OH	OH	2	NO ₂
H	OH	OMe	2	NO ₂
Me	OH	OH	2	NO ₂
Me	OH	OMe	2	NO ₂
benzyl	OH	OH	2	NO ₂
benzyl	OH	OMe	2	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	2	NO ₂
2-phenethyl	OH	OMe	2	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	CN
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	CN
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	CN
allyl	OH	OH	2	CN
allyl	OH	OMe	2	CN
H	OH	OH	2	CN
H	OH	OMe	2	CN
Me	OH	OH	2	CN
Me	OH	OMe	2	CN
benzyl	OH	OH	2	CN
benzyl	OH	OMe	2	CN
2-phenethyl	OH	OH	2	CN
2-phenethyl	OH	OMe	2	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NCS
allyl	OH	OH	2	NCS
allyl	OH	OMe	2	NCS
H	OH	OH	2	NCS
H	OH	OMe	2	NCS
Me	OH	OH	2	NCS
Me	OH	OMe	2	NCS
benzyl	OH	OH	2	NCS
benzyl	OH	OMe	2	NCS
2-phenethyl	OH	OH	2	NCS
2-phenethyl	OH	OMe	2	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	COOH
allyl	OH	OH	2	COOH
allyl	OH	OMe	2	COOH
H	OH	OH	2	COOH
H	OH	OMe	2	COOH
Me	OH	OH	2	COOH
Me	OH	OMe	2	COOH
benzyl	OH	OH	2	COOH
benzyl	OH	OMe	2	COOH
2-phenethyl	OH	OH	2	COOH
2-phenethyl	OH	OMe	2	COOH

R ¹	R ²	R ³	i	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	COOMe
allyl	OH	OH	2	COOMe
allyl	OH	OMe	2	COOMe
H	OH	OH	2	COOMe
H	OH	OMe	2	COOMe
Me	OH	OH	2	COOMe
Me	OH	OMe	2	COOMe
benzyl	OH	OH	2	COOMe
benzyl	OH	OMe	2	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	2	COOMe
2-phenethyl	OH	OMe	2	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	COOEt
allyl	OH	OH	2	COOEt
allyl	OH	OMe	2	COOEt
H	OH	OH	2	COOEt
H	OH	OMe	2	COOEt
Me	OH	OH	2	COOEt
Me	OH	OMe	2	COOEt
benzyl	OH	OH	2	COOEt
benzyl	OH	OMe	2	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	2	COOEt
2-phenethyl	OH	OMe	2	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCHO
allyl	OH	OH	2	NHCHO
allyl	OH	OMe	2	NHCHO
H	OH	OH	2	NHCHO
H	OH	OMe	2	NHCHO
Me	OH	OH	2	NHCHO
Me	OH	OMe	2	NHCHO
benzyl	OH	OH	2	NHCHO
benzyl	OH	OMe	2	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCHO
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-Me
allyl	OH	OH	2	NHCO-Me
allyl	OH	OMe	2	NHCO-Me
H	OH	OH	2	NHCO-Me
H	OH	OMe	2	NHCO-Me
Me	OH	OH	2	NHCO-Me
Me	OH	OMe	2	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	2	NHCO-Me
benzyl	OH	OMe	2	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCO-Me



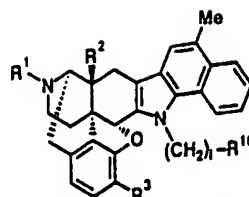
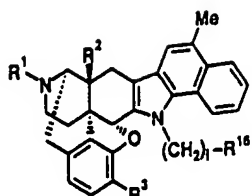
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁰
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
allyl	OH	OMe	2	NHCO-Ph
H	OH	OH	2	NHCO-Ph
H	OH	OMe	2	NHCO-Ph
Me	OH	OH	2	NHCO-Ph
Me	OH	OMe	2	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
benzyl	OH	OMe	2	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OMe	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OMe	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OMe	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OMe	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OMe	2	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
H	OH	OMe	2	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OMe	2	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OMe	2	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OMe	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OMe	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OMe	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OMe	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁰
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OMe	2	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
H	OH	OMe	2	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
Me	OH	OMe	2	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OMe	2	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
allyl	OH	OMe	2	NHCO-NHPh
H	OH	OH	2	NHCO-NHPh
H	OH	OMe	2	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	2	NHCO-NHPh
Me	OH	OMe	2	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OMe	2	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
allyl	OH	OMe	2	NHCS-NHPh
H	OH	OH	2	NHCS-NHPh
H	OH	OMe	2	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	2	NHCS-NHPh
Me	OH	OMe	2	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OMe	2	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OMe	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OMe	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OMe	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OMe	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCS-NHCH ₂ Ph



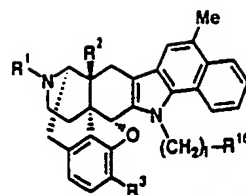
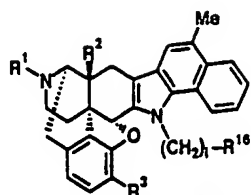
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OH
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	OH
allyl	OH	OH	3	OH
allyl	OH	OMe	3	OH
H	OH	OH	3	OH
H	OH	OMe	3	OH
Me	OH	OH	3	OH
Me	OH	OMe	3	OH
benzyl	OH	OH	3	OH
benzyl	OH	OMe	3	OH
2-phenethyl	OH	OH	3	OH
2-phenethyl	OH	OMe	3	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	OMe
allyl	OH	OH	3	OMe
allyl	OH	OMe	3	OMe
H	OH	OH	3	OMe
H	OH	OMe	3	OMe
Me	OH	OH	3	OMe
Me	OH	OMe	3	OMe
benzyl	OH	OH	3	OMe
benzyl	OH	OMe	3	OMe
2-phenethyl	OH	OH	3	OMe
2-phenethyl	OH	OMe	3	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	OEt
allyl	OH	OH	3	OEt
allyl	OH	OMe	3	OEt
H	OH	OH	3	OEt
H	OH	OMe	3	OEt
Me	OH	OH	3	OEt
Me	OH	OMe	3	OEt
benzyl	OH	OH	3	OEt
benzyl	OH	OMe	3	OEt
2-phenethyl	OH	OH	3	OEt
2-phenethyl	OH	OMe	3	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NH ₂
allyl	OH	OH	3	NH ₂
allyl	OH	OMe	3	NH ₂
H	OH	OH	3	NH ₂
H	OH	OMe	3	NH ₂
Me	OH	OH	3	NH ₂
Me	OH	OMe	3	NH ₂
benzyl	OH	OH	3	NH ₂
benzyl	OH	OMe	3	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	3	NH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	3	NH ₂

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NO ₂
allyl	OH	OH	3	NO ₂
allyl	OH	OMe	3	NO ₂
H	OH	OH	3	NO ₂
H	OH	OMe	3	NO ₂
Me	OH	OH	3	NO ₂
Me	OH	OMe	3	NO ₂
benzyl	OH	OH	3	NO ₂
benzyl	OH	OMe	3	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	3	NO ₂
2-phenethyl	OH	OMe	3	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	CN
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	CN
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	CN
allyl	OH	OH	3	CN
allyl	OH	OMe	3	CN
H	OH	OH	3	CN
H	OH	OMe	3	CN
Me	OH	OH	3	CN
Me	OH	OMe	3	CN
benzyl	OH	OH	3	CN
benzyl	OH	OMe	3	CN
2-phenethyl	OH	OH	3	CN
2-phenethyl	OH	OMe	3	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NCS
allyl	OH	OH	3	NCS
allyl	OH	OMe	3	NCS
H	OH	OH	3	NCS
H	OH	OMe	3	NCS
Me	OH	OH	3	NCS
Me	OH	OMe	3	NCS
benzyl	OH	OH	3	NCS
benzyl	OH	OMe	3	NCS
2-phenethyl	OH	OH	3	NCS
2-phenethyl	OH	OMe	3	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	COOH
allyl	OH	OH	3	COOH
allyl	OH	OMe	3	COOH
H	OH	OH	3	COOH
H	OH	OMe	3	COOH
Me	OH	OH	3	COOH
Me	OH	OMe	3	COOH
benzyl	OH	OH	3	COOH
benzyl	OH	OMe	3	COOH
2-phenethyl	OH	OH	3	COOH
2-phenethyl	OH	OMe	3	COOH



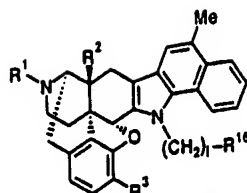
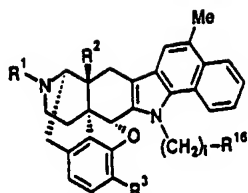
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁸
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	COOMe
allyl	OH	OH	3	COOMe
allyl	OH	OMe	3	COOMe
H	OH	OH	3	COOMe
H	OH	OMe	3	COOMe
Me	OH	OH	3	COOMe
Me	OH	OMe	3	COOMe
benzyl	OH	OH	3	COOMe
benzyl	OH	OMe	3	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	3	COOMe
2-phenethyl	OH	OMe	3	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	COOEt
allyl	OH	OH	3	COOEt
allyl	OH	OMe	3	COOEt
H	OH	OH	3	COOEt
H	OH	OMe	3	COOEt
Me	OH	OH	3	COOEt
Me	OH	OMe	3	COOEt
benzyl	OH	OH	3	COOEt
benzyl	OH	OMe	3	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	3	COOEt
2-phenethyl	OH	OMe	3	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCHO
allyl	OH	OH	3	NHCHO
allyl	OH	OMe	3	NHCHO
H	OH	OH	3	NHCHO
H	OH	OMe	3	NHCHO
Me	OH	OH	3	NHCHO
Me	OH	OMe	3	NHCHO
benzyl	OH	OH	3	NHCHO
benzyl	OH	OMe	3	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCHO
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Me
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-Me
allyl	OH	OH	3	NHCO-Me
allyl	OH	OMe	3	NHCO-Me
H	OH	OH	3	NHCO-Me
H	OH	OMe	3	NHCO-Me
Me	OH	OH	3	NHCO-Me
Me	OH	OMe	3	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	3	NHCO-Me
benzyl	OH	OMe	3	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCO-Me

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁸
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
allyl	OH	OMe	3	NHCO-Ph
H	OH	OH	3	NHCO-Ph
H	OH	OMe	3	NHCO-Ph
Me	OH	OH	3	NHCO-Ph
Me	OH	OMe	3	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
benzyl	OH	OMe	3	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OMe	3	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
H	OH	OMe	3	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OMe	3	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OMe	3	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)



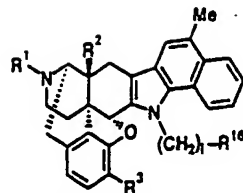
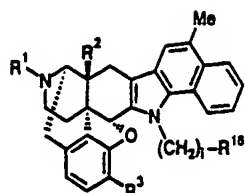
R ¹	R ²	R ³	i	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
H	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
Me	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
allyl	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
H	OH	OH	3	NHCO-NHPh
H	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	3	NHCO-NHPh
Me	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
allyl	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
H	OH	OH	3	NHCS-NHPh
H	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	3	NHCS-NHPh
Me	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OMe	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OMe	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OMe	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OMe	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHCH ₂ Ph

R ¹	R ²	R ³	i	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OH
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	OH
allyl	OH	OH	4	OH
allyl	OH	OMe	4	OH
H	OH	OH	4	OH
H	OH	OMe	4	OH
Me	OH	OH	4	OH
Me	OH	OMe	4	OH
benzyl	OH	OH	4	OH
benzyl	OH	OMe	4	OH
2-phenethyl	OH	OH	4	OH
2-phenethyl	OH	OMe	4	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	OMe
allyl	OH	OH	4	OMe
allyl	OH	OMe	4	OMe
H	OH	OH	4	OMe
H	OH	OMe	4	OMe
Me	OH	OH	4	OMe
Me	OH	OMe	4	OMe
benzyl	OH	OH	4	OMe
benzyl	OH	OMe	4	OMe
2-phenethyl	OH	OH	4	OMe
2-phenethyl	OH	OMe	4	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	OEt
allyl	OH	OH	4	OEt
allyl	OH	OMe	4	OEt
H	OH	OH	4	OEt
H	OH	OMe	4	OEt
Me	OH	OH	4	OEt
Me	OH	OMe	4	OEt
benzyl	OH	OH	4	OEt
benzyl	OH	OMe	4	OEt
2-phenethyl	OH	OH	4	OEt
2-phenethyl	OH	OMe	4	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NH ₂
allyl	OH	OH	4	NH ₂
allyl	OH	OMe	4	NH ₂
H	OH	OH	4	NH ₂
H	OH	OMe	4	NH ₂
Me	OH	OH	4	NH ₂
Me	OH	OMe	4	NH ₂
benzyl	OH	OH	4	NH ₂
benzyl	OH	OMe	4	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	4	NH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	4	NH ₂



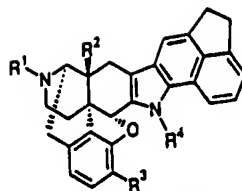
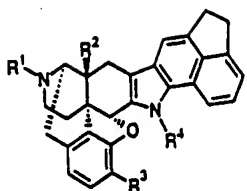
R ¹	R ²	R ³	l	R ⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NO ₂
allyl	OH	OH	4	NO ₂
allyl	OH	OMe	4	NO ₂
H	OH	OH	4	NO ₂
H	OH	OMe	4	NO ₂
Me	OH	OH	4	NO ₂
Me	OH	OMe	4	NO ₂
benzyl	OH	OH	4	NO ₂
benzyl	OH	OMe	4	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	4	NO ₂
2-phenethyl	OH	OMe	4	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	CN
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	CN
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	CN
allyl	OH	OH	4	CN
allyl	OH	OMe	4	CN
H	OH	OH	4	CN
H	OH	OMe	4	CN
Me	OH	OH	4	CN
Me	OH	OMe	4	CN
benzyl	OH	OH	4	CN
benzyl	OH	OMe	4	CN
2-phenethyl	OH	OH	4	CN
2-phenethyl	OH	OMe	4	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NCS
allyl	OH	OH	4	NCS
allyl	OH	OMe	4	NCS
H	OH	OH	4	NCS
H	OH	OMe	4	NCS
Me	OH	OH	4	NCS
Me	OH	OMe	4	NCS
benzyl	OH	OH	4	NCS
benzyl	OH	OMe	4	NCS
2-phenethyl	OH	OH	4	NCS
2-phenethyl	OH	OMe	4	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	COOH
allyl	OH	OH	4	COOH
allyl	OH	OMe	4	COOH
H	OH	OH	4	COOH
H	OH	OMe	4	COOH
Me	OH	OH	4	COOH
Me	OH	OMe	4	COOH
benzyl	OH	OH	4	COOH
benzyl	OH	OMe	4	COOH
2-phenethyl	OH	OH	4	COOH
2-phenethyl	OH	OMe	4	COOH

R ¹	R ²	R ³	l	R ⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	COOMe
allyl	OH	OH	4	COOMe
allyl	OH	OMe	4	COOMe
H	OH	OH	4	COOMe
H	OH	OMe	4	COOMe
Me	OH	OH	4	COOMe
Me	OH	OMe	4	COOMe
benzyl	OH	OH	4	COOMe
benzyl	OH	OMe	4	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	4	COOMe
2-phenethyl	OH	OMe	4	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	COOEt
allyl	OH	OH	4	COOEt
allyl	OH	OMe	4	COOEt
H	OH	OH	4	COOEt
H	OH	OMe	4	COOEt
Me	OH	OH	4	COOEt
Me	OH	OMe	4	COOEt
benzyl	OH	OH	4	COOEt
benzyl	OH	OMe	4	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	4	COOEt
2-phenethyl	OH	OMe	4	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCHO
allyl	OH	OH	4	NHCHO
allyl	OH	OMe	4	NHCHO
H	OH	OH	4	NHCHO
H	OH	OMe	4	NHCHO
Me	OH	OH	4	NHCHO
Me	OH	OMe	4	NHCHO
benzyl	OH	OH	4	NHCHO
benzyl	OH	OMe	4	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCHO
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-Me
allyl	OH	OH	4	NHCO-Me
allyl	OH	OMe	4	NHCO-Me
H	OH	OH	4	NHCO-Me
H	OH	OMe	4	NHCO-Me
Me	OH	OH	4	NHCO-Me
Me	OH	OMe	4	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	4	NHCO-Me
benzyl	OH	OMe	4	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCO-Me



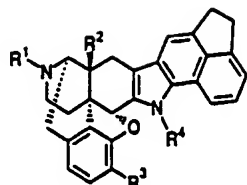
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
allyl	OH	OMe	4	NHCO-Ph
H	OH	OH	4	NHCO-Ph
H	OH	OMe	4	NHCO-Ph
Me	OH	OH	4	NHCO-Ph
Me	OH	OMe	4	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
benzyl	OH	OMe	4	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OMe	4	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
H	OH	OMe	4	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OMe	4	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OMe	4	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
H	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
Me	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
allyl	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
H	OH	OH	4	NHCO-NHPh
H	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	4	NHCO-NHPh
Me	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
allyl	OH	OMe	4	NHCS-NHPh
H	OH	OH	4	NHCS-NHPh
H	OH	OMe	4	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	4	NHCS-NHPh
Me	OH	OMe	4	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OMe	4	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OMe	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OMe	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OMe	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OMe	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHCH ₂ Ph

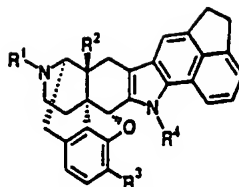


R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	H
cyclopropylmethyl	OH	OMe	H
cyclobutylmethyl	OH	OH	H
cyclobutylmethyl	OH	OMe	H
allyl	OH	OH	H
allyl	OH	OMe	H
H	OH	OH	H
H	OH	OMe	H
Me	OH	OH	H
Me	OH	OMe	H
benzyl	OH	OH	H
benzyl	OH	OMe	H
2-phenethyl	OH	OH	H
2-phenethyl	OH	OMe	H
cyclopropylmethyl	OH	OH	Me
cyclopropylmethyl	OH	OMe	Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	Me
cyclobutylmethyl	OH	OMe	Me
allyl	OH	OH	Me
allyl	OH	OMe	Me
H	OH	OH	Me
H	OH	OMe	Me
Me	OH	OH	Me
Me	OH	OMe	Me
benzyl	OH	OH	Me
benzyl	OH	OMe	Me
2-phenethyl	OH	OH	Me
2-phenethyl	OH	OMe	Me
cyclopropylmethyl	OH	OH	Et
cyclopropylmethyl	OH	OMe	Et
cyclobutylmethyl	OH	OH	Et
cyclobutylmethyl	OH	OMe	Et
allyl	OH	OH	Et
allyl	OH	OMe	Et
H	OH	OH	Et
H	OH	OMe	Et
Me	OH	OH	Et
Me	OH	OMe	Et
benzyl	OH	OH	Et
benzyl	OH	OMe	Et
2-phenethyl	OH	OH	Et
2-phenethyl	OH	OMe	Et
cyclopropylmethyl	OH	OH	Bu
cyclopropylmethyl	OH	OMe	Bu
cyclobutylmethyl	OH	OH	Bu
cyclobutylmethyl	OH	OMe	Bu
allyl	OH	OH	Bu
allyl	OH	OMe	Bu
H	OH	OH	Bu
H	OH	OMe	Bu
Me	OH	OH	Bu
Me	OH	OMe	Bu
benzyl	OH	OH	Bu
benzyl	OH	OMe	Bu
2-phenethyl	OH	OH	Bu
2-phenethyl	OH	OMe	Bu

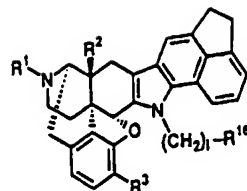
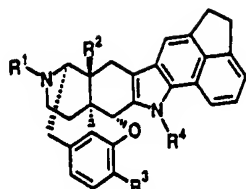
R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhCH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	PhCH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhCH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	PhCH ₂
allyl	OH	OH	PhCH ₂
allyl	OH	OMe	PhCH ₂
H	OH	OH	PhCH ₂
H	OH	OMe	PhCH ₂
Me	OH	OH	PhCH ₂
Me	OH	OMe	PhCH ₂
benzyl	OH	OH	PhCH ₂
benzyl	OH	OMe	PhCH ₂
2-phenethyl	OH	OH	PhCH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	PhCH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OMe	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OMe	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OMe	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OMe	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OMe	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OMe	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OMe	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OMe	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OMe	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OMe	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OMe	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OMe	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂



R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OMe	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OMe	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OMe	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OMe	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OMe	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OMe	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OMe	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OMe	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OMe	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OMe	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OMe	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OMe	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂

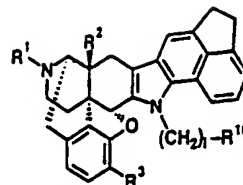
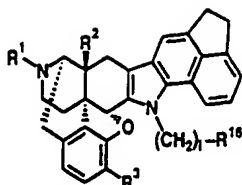


R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₂
allyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
allyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₂
H	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
H	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₂
Me	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
Me	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₂
benzyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
benzyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₂
2-phenethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
2-phenethyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
cyclopropylmethyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₃
cyclobutylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
cyclobutylmethyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₃
allyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
allyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₃
H	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
H	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₃
Me	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
Me	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₃
benzyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
benzyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₃
2-phenethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
2-phenethyl	OH	OMe	Ph(CH ₂) ₃
cyclopropylmethyl	OH	OH	MeCO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	MeCO
cyclobutylmethyl	OH	OH	MeCO
cyclobutylmethyl	OH	OMe	MeCO
allyl	OH	OH	MeCO
allyl	OH	OMe	MeCO
H	OH	OH	MeCO
H	OH	OMe	MeCO
Me	OH	OH	MeCO
Me	OH	OMe	MeCO
benzyl	OH	OH	MeCO
benzyl	OH	OMe	MeCO
2-phenethyl	OH	OH	MeCO
2-phenethyl	OH	OMe	MeCO
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhCO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	PhCO
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhCO
cyclobutylmethyl	OH	OMe	PhCO
allyl	OH	OH	PhCO
allyl	OH	OMe	PhCO
H	OH	OH	PhCO
H	OH	OMe	PhCO
Me	OH	OH	PhCO
Me	OH	OMe	PhCO
benzyl	OH	OH	PhCO
benzyl	OH	OMe	PhCO
2-phenethyl	OH	OH	PhCO
2-phenethyl	OH	OMe	PhCO



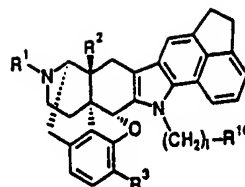
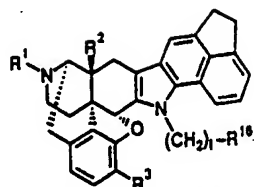
R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	MeSO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	MeSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	MeSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	MeSO ₂
allyl	OH	OH	MeSO ₂
allyl	OH	OMe	MeSO ₂
H	OH	OH	MeSO ₂
H	OH	OMe	MeSO ₂
Me	OH	OH	MeSO ₂
Me	OH	OMe	MeSO ₂
benzyl	OH	OH	MeSO ₂
benzyl	OH	OMe	MeSO ₂
2-phenethyl	OH	OH	MeSO ₂
2-phenethyl	OH	OMe	MeSO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhSO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	PhSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	PhSO ₂
allyl	OH	OH	PhSO ₂
allyl	OH	OMe	PhSO ₂
H	OH	OH	PhSO ₂
H	OH	OMe	PhSO ₂
Me	OH	OH	PhSO ₂
Me	OH	OMe	PhSO ₂
benzyl	OH	OH	PhSO ₂
benzyl	OH	OMe	PhSO ₂
2-phenethyl	OH	OH	PhSO ₂
2-phenethyl	OH	OMe	PhSO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
allyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
allyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
H	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
H	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
Me	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
Me	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
benzyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
benzyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
2-phenethyl	OH	OMe	(Me-C ₆ H ₄)SO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhCH ₂ SO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	PhCH ₂ SO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhCH ₂ SO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	PhCH ₂ SO ₂
allyl	OH	OH	PhCH ₂ SO ₂
allyl	OH	OMe	PhCH ₂ SO ₂
H	OH	OH	PhCH ₂ SO ₂
H	OH	OMe	PhCH ₂ SO ₂
Me	OH	OH	PhCH ₂ SO ₂
Me	OH	OMe	PhCH ₂ SO ₂
benzyl	OH	OH	PhCH ₂ SO ₂
benzyl	OH	OMe	PhCH ₂ SO ₂
2-phenethyl	OH	OH	PhCH ₂ SO ₂
2-phenethyl	OH	OMe	PhCH ₂ SO ₂

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OH
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	OH
allyl	OH	OH	2	OH
allyl	OH	OMe	2	OH
H	OH	OH	2	OH
H	OH	OMe	2	OH
Me	OH	OH	2	OH
Me	OH	OMe	2	OH
benzyl	OH	OH	2	OH
benzyl	OH	OMe	2	OH
2-phenethyl	OH	OH	2	OH
2-phenethyl	OH	OMe	2	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	OMe
allyl	OH	OH	2	OMe
allyl	OH	OMe	2	OMe
H	OH	OH	2	OMe
H	OH	OMe	2	OMe
Me	OH	OH	2	OMe
Me	OH	OMe	2	OMe
benzyl	OH	OH	2	OMe
benzyl	OH	OMe	2	OMe
2-phenethyl	OH	OH	2	OMe
2-phenethyl	OH	OMe	2	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	OEt
allyl	OH	OH	2	OEt
allyl	OH	OMe	2	OEt
H	OH	OH	2	OEt
H	OH	OMe	2	OEt
Me	OH	OH	2	OEt
Me	OH	OMe	2	OEt
benzyl	OH	OH	2	OEt
benzyl	OH	OMe	2	OEt
2-phenethyl	OH	OH	2	OEt
2-phenethyl	OH	OMe	2	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NH ₂
allyl	OH	OH	2	NH ₂
allyl	OH	OMe	2	NH ₂
H	OH	OH	2	NH ₂
H	OH	OMe	2	NH ₂
Me	OH	OH	2	NH ₂
Me	OH	OMe	2	NH ₂
benzyl	OH	OH	2	NH ₂
benzyl	OH	OMe	2	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	2	NH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	2	NH ₂



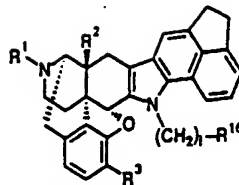
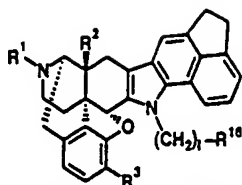
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁸
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NO ₂
allyl	OH	OH	2	NO ₂
allyl	OH	OMe	2	NO ₂
H	OH	OH	2	NO ₂
H	OH	OMe	2	NO ₂
Me	OH	OH	2	NO ₂
Me	OH	OMe	2	NO ₂
benzyl	OH	OH	2	NO ₂
benzyl	OH	OMe	2	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	2	NO ₂
2-phenethyl	OH	OMe	2	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	CN
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	CN
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	CN
allyl	OH	OH	2	CN
allyl	OH	OMe	2	CN
H	OH	OH	2	CN
H	OH	OMe	2	CN
Me	OH	OH	2	CN
Me	OH	OMe	2	CN
benzyl	OH	OH	2	CN
benzyl	OH	OMe	2	CN
2-phenethyl	OH	OH	2	CN
2-phenethyl	OH	OMe	2	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NCS
allyl	OH	OH	2	NCS
allyl	OH	OMe	2	NCS
H	OH	OH	2	NCS
H	OH	OMe	2	NCS
Me	OH	OH	2	NCS
Me	OH	OMe	2	NCS
benzyl	OH	OH	2	NCS
benzyl	OH	OMe	2	NCS
2-phenethyl	OH	OH	2	NCS
2-phenethyl	OH	OMe	2	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	COOH
allyl	OH	OH	2	COOH
allyl	OH	OMe	2	COOH
H	OH	OH	2	COOH
H	OH	OMe	2	COOH
Me	OH	OH	2	COOH
Me	OH	OMe	2	COOH
benzyl	OH	OH	2	COOH
benzyl	OH	OMe	2	COOH
2-phenethyl	OH	OH	2	COOH
2-phenethyl	OH	OMe	2	COOH

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁸
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	COOMe
allyl	OH	OH	2	COOMe
allyl	OH	OMe	2	COOMe
H	OH	OH	2	COOMe
H	OH	OMe	2	COOMe
Me	OH	OH	2	COOMe
Me	OH	OMe	2	COOMe
benzyl	OH	OH	2	COOMe
benzyl	OH	OMe	2	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	2	COOMe
2-phenethyl	OH	OMe	2	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	COOEt
allyl	OH	OH	2	COOEt
allyl	OH	OMe	2	COOEt
H	OH	OH	2	COOEt
H	OH	OMe	2	COOEt
Me	OH	OH	2	COOEt
Me	OH	OMe	2	COOEt
benzyl	OH	OH	2	COOEt
benzyl	OH	OMe	2	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	2	COOEt
2-phenethyl	OH	OMe	2	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCHO
allyl	OH	OH	2	NHCHO
allyl	OH	OMe	2	NHCHO
H	OH	OH	2	NHCHO
H	OH	OMe	2	NHCHO
Me	OH	OH	2	NHCHO
Me	OH	OMe	2	NHCHO
benzyl	OH	OH	2	NHCHO
benzyl	OH	OMe	2	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCHO
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-Me
allyl	OH	OH	2	NHCO-Me
allyl	OH	OMe	2	NHCO-Me
H	OH	OH	2	NHCO-Me
H	OH	OMe	2	NHCO-Me
Me	OH	OH	2	NHCO-Me
Me	OH	OMe	2	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	2	NHCO-Me
benzyl	OH	OMe	2	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCO-Me



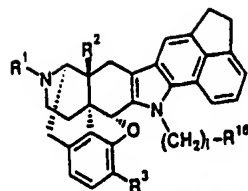
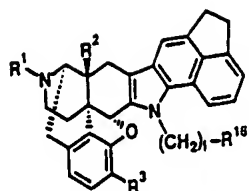
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
allyl	OH	OMe	2	NHCO-Ph
H	OH	OH	2	NHCO-Ph
H	OH	OMe	2	NHCO-Ph
Me	OH	OH	2	NHCO-Ph
Me	OH	OMe	2	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
benzyl	OH	OMe	2	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OMe	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OMe	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OMe	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OMe	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OMe	2	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
H	OH	OMe	2	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OMe	2	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OMe	2	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OMe	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OMe	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OMe	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OMe	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OMe	2	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
H	OH	OMe	2	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
Me	OH	OMe	2	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OMe	2	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
allyl	OH	OMe	2	NHCO-NHPh
H	OH	OH	2	NHCO-NHPh
H	OH	OMe	2	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	2	NHCO-NHPh
Me	OH	OMe	2	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OMe	2	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
allyl	OH	OMe	2	NHCS-NHPh
H	OH	OH	2	NHCS-NHPh
H	OH	OMe	2	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	2	NHCS-NHPh
Me	OH	OMe	2	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OMe	2	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OMe	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OMe	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OMe	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OMe	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OMe	2	NHCS-NHCH ₂ Ph



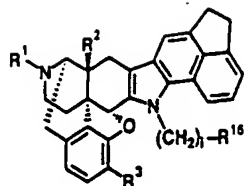
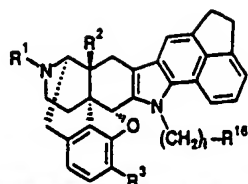
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OH
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	OH
allyl	OH	OH	3	OH
allyl	OH	OMe	3	OH
H	OH	OH	3	OH
H	OH	OMe	3	OH
Me	OH	OH	3	OH
Me	OH	OMe	3	OH
benzyl	OH	OH	3	OH
benzyl	OH	OMe	3	OH
2-phenethyl	OH	OH	3	OH
2-phenethyl	OH	OMe	3	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	OMe
allyl	OH	OH	3	OMe
allyl	OH	OMe	3	OMe
H	OH	OH	3	OMe
H	OH	OMe	3	OMe
Me	OH	OH	3	OMe
Me	OH	OMe	3	OMe
benzyl	OH	OH	3	OMe
benzyl	OH	OMe	3	OMe
2-phenethyl	OH	OH	3	OMe
2-phenethyl	OH	OMe	3	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OEi
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	OEi
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OEi
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	OEi
allyl	OH	OH	3	OEi
allyl	OH	OMe	3	OEi
H	OH	OH	3	OEi
H	OH	OMe	3	OEi
Me	OH	OH	3	OEi
Me	OH	OMe	3	OEi
benzyl	OH	OH	3	OEi
benzyl	OH	OMe	3	OEi
2-phenethyl	OH	OH	3	OEi
2-phenethyl	OH	OMe	3	OEi
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NH ₂
allyl	OH	OH	3	NH ₂
allyl	OH	OMe	3	NH ₂
H	OH	OH	3	NH ₂
H	OH	OMe	3	NH ₂
Me	OH	OH	3	NH ₂
Me	OH	OMe	3	NH ₂
benzyl	OH	OH	3	NH ₂
benzyl	OH	OMe	3	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	3	NH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	3	NH ₂

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NO ₂
allyl	OH	OH	3	NO ₂
allyl	OH	OMe	3	NO ₂
H	OH	OH	3	NO ₂
H	OH	OMe	3	NO ₂
Me	OH	OH	3	NO ₂
Me	OH	OMe	3	NO ₂
benzyl	OH	OH	3	NO ₂
benzyl	OH	OMe	3	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	3	NO ₂
2-phenethyl	OH	OMe	3	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	CN
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	CN
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	CN
allyl	OH	OH	3	CN
allyl	OH	OMe	3	CN
H	OH	OH	3	CN
H	OH	OMe	3	CN
Me	OH	OH	3	CN
Me	OH	OMe	3	CN
benzyl	OH	OH	3	CN
benzyl	OH	OMe	3	CN
2-phenethyl	OH	OH	3	CN
2-phenethyl	OH	OMe	3	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NCS
allyl	OH	OH	3	NCS
allyl	OH	OMe	3	NCS
H	OH	OH	3	NCS
H	OH	OMe	3	NCS
Me	OH	OH	3	NCS
Me	OH	OMe	3	NCS
benzyl	OH	OH	3	NCS
benzyl	OH	OMe	3	NCS
2-phenethyl	OH	OH	3	NCS
2-phenethyl	OH	OMe	3	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	COOH
allyl	OH	OH	3	COOH
allyl	OH	OMe	3	COOH
H	OH	OH	3	COOH
H	OH	OMe	3	COOH
Me	OH	OH	3	COOH
Me	OH	OMe	3	COOH
benzyl	OH	OH	3	COOH
benzyl	OH	OMe	3	COOH
2-phenethyl	OH	OH	3	COOH
2-phenethyl	OH	OMe	3	COOH



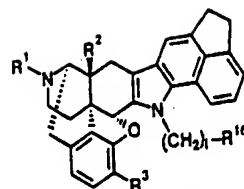
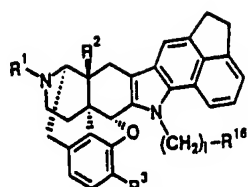
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOMe
allyl	OH	OMe	3	COOMe
allyl	OH	OH	3	COOMe
H	OH	OMe	3	COOMe
H	OH	OH	3	COOMe
Me	OH	OMe	3	COOMe
Me	OH	OH	3	COOMe
benzyl	OH	OMe	3	COOMe
benzyl	OH	OH	3	COOMe
2-phenethyl	OH	OMe	3	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	3	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	COOEt
allyl	OH	OH	3	COOEt
allyl	OH	OMe	3	COOEt
H	OH	OH	3	COOEt
H	OH	OMe	3	COOEt
Me	OH	OH	3	COOEt
Me	OH	OMe	3	COOEt
benzyl	OH	OH	3	COOEt
benzyl	OH	OMe	3	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	3	COOEt
2-phenethyl	OH	OMe	3	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCHO
allyl	OH	OH	3	NHCHO
allyl	OH	OMe	3	NHCHO
H	OH	OH	3	NHCHO
H	OH	OMe	3	NHCHO
Me	OH	OH	3	NHCHO
Me	OH	OMe	3	NHCHO
benzyl	OH	OH	3	NHCHO
benzyl	OH	OMe	3	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCHO
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Me
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-Me
allyl	OH	OH	3	NHCO-Me
allyl	OH	OMe	3	NHCO-Me
H	OH	OH	3	NHCO-Me
H	OH	OMe	3	NHCO-Me
Me	OH	OH	3	NHCO-Me
Me	OH	OMe	3	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	3	NHCO-Me
benzyl	OH	OMe	3	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCO-Me

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
allyl	OH	OMe	3	NHCO-Ph
H	OH	OH	3	NHCO-Ph
H	OH	OMe	3	NHCO-Ph
Me	OH	OH	3	NHCO-Ph
Me	OH	OMe	3	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
benzyl	OH	OMe	3	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OMe	3	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
H	OH	OMe	3	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OMe	3	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OMe	3	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)



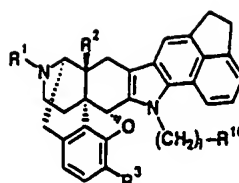
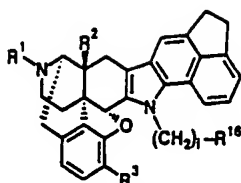
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
H	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
Me	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
allyl	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
H	OH	OH	3	NHCO-NHPh
H	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	3	NHCO-NHPh
Me	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
allyl	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
H	OH	OH	3	NHCS-NHPh
H	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	3	NHCS-NHPh
Me	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OMe	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OMe	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OMe	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OMe	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHCH ₂ Ph

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OH
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	OH
allyl	OH	OH	4	OH
allyl	OH	OMe	4	OH
H	OH	OH	4	OH
H	OH	OMe	4	OH
Me	OH	OH	4	OH
Me	OH	OMe	4	OH
benzyl	OH	OH	4	OH
benzyl	OH	OMe	4	OH
2-phenethyl	OH	OH	4	OH
2-phenethyl	OH	OMe	4	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	OMe
allyl	OH	OH	4	OMe
allyl	OH	OMe	4	OMe
H	OH	OH	4	OMe
H	OH	OMe	4	OMe
Me	OH	OH	4	OMe
Me	OH	OMe	4	OMe
benzyl	OH	OH	4	OMe
benzyl	OH	OMe	4	OMe
2-phenethyl	OH	OH	4	OMe
2-phenethyl	OH	OMe	4	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	OEt
allyl	OH	OH	4	OEt
allyl	OH	OMe	4	OEt
H	OH	OH	4	OEt
H	OH	OMe	4	OEt
Me	OH	OH	4	OEt
Me	OH	OMe	4	OEt
benzyl	OH	OH	4	OEt
benzyl	OH	OMe	4	OEt
2-phenethyl	OH	OH	4	OEt
2-phenethyl	OH	OMe	4	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NH ₂
allyl	OH	OH	4	NH ₂
allyl	OH	OMe	4	NH ₂
H	OH	OH	4	NH ₂
H	OH	OMe	4	NH ₂
Me	OH	OH	4	NH ₂
Me	OH	OMe	4	NH ₂
benzyl	OH	OH	4	NH ₂
benzyl	OH	OMe	4	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	4	NH ₂
2-phenethyl	OH	OMe	4	NH ₂



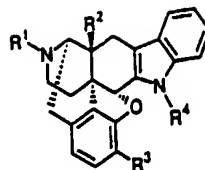
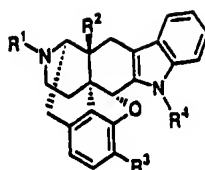
R ¹	R ²	R ³	i	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NO ₂
allyl	OH	OH	4	NO ₂
allyl	OH	OMe	4	NO ₂
H	OH	OH	4	NO ₂
H	OH	OMe	4	NO ₂
Me	OH	OH	4	NO ₂
Me	OH	OMe	4	NO ₂
benzyl	OH	OH	4	NO ₂
benzyl	OH	OMe	4	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	4	NO ₂
2-phenethyl	OH	OMe	4	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	CN
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	CN
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	CN
allyl	OH	OH	4	CN
allyl	OH	OMe	4	CN
H	OH	OH	4	CN
H	OH	OMe	4	CN
Me	OH	OH	4	CN
Me	OH	OMe	4	CN
benzyl	OH	OH	4	CN
benzyl	OH	OMe	4	CN
2-phenethyl	OH	OH	4	CN
2-phenethyl	OH	OMe	4	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NCS
allyl	OH	OH	4	NCS
allyl	OH	OMe	4	NCS
H	OH	OH	4	NCS
H	OH	OMe	4	NCS
Me	OH	OH	4	NCS
Me	OH	OMe	4	NCS
benzyl	OH	OH	4	NCS
benzyl	OH	OMe	4	NCS
2-phenethyl	OH	OH	4	NCS
2-phenethyl	OH	OMe	4	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	COOH
allyl	OH	OH	4	COOH
allyl	OH	OMe	4	COOH
H	OH	OH	4	COOH
H	OH	OMe	4	COOH
Me	OH	OH	4	COOH
Me	OH	OMe	4	COOH
benzyl	OH	OH	4	COOH
benzyl	OH	OMe	4	COOH
2-phenethyl	OH	OH	4	COOH
2-phenethyl	OH	OMe	4	COOH

R ¹	R ²	R ³	i	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	COOMe
allyl	OH	OH	4	COOMe
allyl	OH	OMe	4	COOMe
H	OH	OH	4	COOMe
H	OH	OMe	4	COOMe
Me	OH	OH	4	COOMe
Me	OH	OMe	4	COOMe
benzyl	OH	OH	4	COOMe
benzyl	OH	OMe	4	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	4	COOMe
2-phenethyl	OH	OMe	4	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	COOEt
allyl	OH	OH	4	COOEt
allyl	OH	OMe	4	COOEt
H	OH	OH	4	COOEt
H	OH	OMe	4	COOEt
Me	OH	OH	4	COOEt
Me	OH	OMe	4	COOEt
benzyl	OH	OH	4	COOEt
benzyl	OH	OMe	4	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	4	COOEt
2-phenethyl	OH	OMe	4	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCHO
allyl	OH	OH	4	NHCHO
allyl	OH	OMe	4	NHCHO
H	OH	OH	4	NHCHO
H	OH	OMe	4	NHCHO
Me	OH	OH	4	NHCHO
Me	OH	OMe	4	NHCHO
benzyl	OH	OH	4	NHCHO
benzyl	OH	OMe	4	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCHO
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-Me
allyl	OH	OH	4	NHCO-Me
allyl	OH	OMe	4	NHCO-Me
H	OH	OH	4	NHCO-Me
H	OH	OMe	4	NHCO-Me
Me	OH	OH	4	NHCO-Me
Me	OH	OMe	4	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	4	NHCO-Me
benzyl	OH	OMe	4	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCO-Me



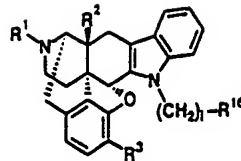
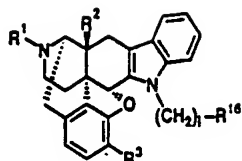
R ¹	R ²	R ³	I	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
allyl	OH	OMe	4	NHCO-Ph
H	OH	OH	4	NHCO-Ph
H	OH	OMe	4	NHCO-Ph
Me	OH	OH	4	NHCO-Ph
Me	OH	OMe	4	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
benzyl	OH	OMe	4	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OMe	4	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
H	OH	OMe	4	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OMe	4	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OMe	4	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)

R ¹	R ²	R ³	I	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
H	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
Me	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
allyl	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
H	OH	OH	4	NHCO-NHPh
H	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	4	NHCO-NHPh
Me	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
allyl	OH	OMe	4	NHCS-NHPh
H	OH	OH	4	NHCS-NHPh
H	OH	OMe	4	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	4	NHCS-NHPh
Me	OH	OMe	4	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OMe	4	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OMe	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OMe	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OMe	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OMe	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHCH ₂ Ph



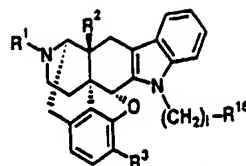
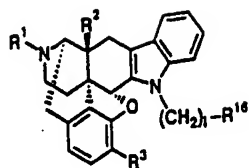
R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	H
cyclobutylmethyl	OH	OH	H
allyl	OH	OH	H
H	OH	OH	H
Me	OH	OH	H
benzyl	OH	OH	H
2-phenethyl	OH	OH	H
cyclopropylmethyl	OH	OH	Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	Me
allyl	OH	OH	Me
H	OH	OH	Me
Me	OH	OH	Me
benzyl	OH	OH	Me
2-phenethyl	OH	OH	Me
cyclopropylmethyl	OH	OH	Bu
cyclobutylmethyl	OH	OH	Bu
allyl	OH	OH	Bu
H	OH	OH	Bu
Me	OH	OH	Bu
benzyl	OH	OH	Bu
2-phenethyl	OH	OH	Bu
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhCH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhCH ₂
allyl	OH	OH	PhCH ₂
H	OH	OH	PhCH ₂
Me	OH	OH	PhCH ₂
benzyl	OH	OH	PhCH ₂
2-phenethyl	OH	OH	PhCH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂

R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
allyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
H	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
Me	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
benzyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
2-phenethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
cyclobutylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
allyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
H	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
Me	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
benzyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
2-phenethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhCO
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhCO
allyl	OH	OH	PhCO
H	OH	OH	PhCO
Me	OH	OH	PhCO
benzyl	OH	OH	PhCO
2-phenethyl	OH	OH	PhCO
cyclopropylmethyl	OH	OH	MeSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	MeSO ₂
allyl	OH	OH	MeSO ₂
H	OH	OH	MeSO ₂
Me	OH	OH	MeSO ₂
benzyl	OH	OH	MeSO ₂
2-phenethyl	OH	OH	MeSO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhSO ₂
allyl	OH	OH	PhSO ₂
H	OH	OH	PhSO ₂
Me	OH	OH	PhSO ₂
benzyl	OH	OH	PhSO ₂
2-phenethyl	OH	OH	PhSO ₂



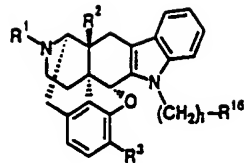
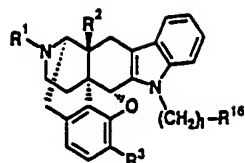
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OH
allyl	OH	OH	2	OH
H	OH	OH	2	OH
Me	OH	OH	2	OH
benzyl	OH	OH	2	OH
2-phenethyl	OH	OH	2	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OMe
allyl	OH	OH	2	OMe
H	OH	OH	2	OMe
Me	OH	OH	2	OMe
benzyl	OH	OH	2	OMe
2-phenethyl	OH	OH	2	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OEt
allyl	OH	OH	2	OEt
H	OH	OH	2	OEt
Me	OH	OH	2	OEt
benzyl	OH	OH	2	OEt
2-phenethyl	OH	OH	2	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NH ₂
allyl	OH	OH	2	NH ₂
H	OH	OH	2	NH ₂
Me	OH	OH	2	NH ₂
benzyl	OH	OH	2	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	2	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NO ₂
allyl	OH	OH	2	NO ₂
H	OH	OH	2	NO ₂
Me	OH	OH	2	NO ₂
benzyl	OH	OH	2	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	2	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	CN
allyl	OH	OH	2	CN
H	OH	OH	2	CN
Me	OH	OH	2	CN
benzyl	OH	OH	2	CN
2-phenethyl	OH	OH	2	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NCS
allyl	OH	OH	2	NCS
H	OH	OH	2	NCS
Me	OH	OH	2	NCS
benzyl	OH	OH	2	NCS
2-phenethyl	OH	OH	2	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOH
allyl	OH	OH	2	COOH
H	OH	OH	2	COOH
Me	OH	OH	2	COOH
benzyl	OH	OH	2	COOH
2-phenethyl	OH	OH	2	COOH

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOMe
allyl	OH	OH	2	COOMe
H	OH	OH	2	COOMe
Me	OH	OH	2	COOMe
benzyl	OH	OH	2	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	2	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOEt
allyl	OH	OH	2	COOEt
H	OH	OH	2	COOEt
Me	OH	OH	2	COOEt
benzyl	OH	OH	2	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	2	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCHO
allyl	OH	OH	2	NHCHO
H	OH	OH	2	NHCHO
Me	OH	OH	2	NHCHO
benzyl	OH	OH	2	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
allyl	OH	OH	2	NHCO-Me
H	OH	OH	2	NHCO-Me
Me	OH	OH	2	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	2	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
H	OH	OH	2	NHCO-Ph
Me	OH	OH	2	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)



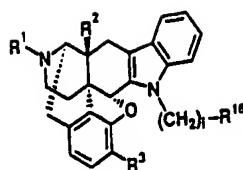
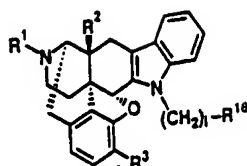
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁸
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
H	OH	OH	2	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	2	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
H	OH	OH	2	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	2	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OH
allyl	OH	OH	3	OH
H	OH	OH	3	OH
Me	OH	OH	3	OH
benzyl	OH	OH	3	OH
2-phenethyl	OH	OH	3	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OMe
allyl	OH	OH	3	OMe
H	OH	OH	3	OMe
Me	OH	OH	3	OMe
benzyl	OH	OH	3	OMe
2-phenethyl	OH	OH	3	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OEi
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OEi
allyl	OH	OH	3	OEi
H	OH	OH	3	OEi
Me	OH	OH	3	OEi
benzyl	OH	OH	3	OEi
2-phenethyl	OH	OH	3	OEi
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NH ₂
allyl	OH	OH	3	NH ₂
H	OH	OH	3	NH ₂
Me	OH	OH	3	NH ₂
benzyl	OH	OH	3	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	3	NH ₂

R'	R ⁴	R ²	I	R ¹⁰
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NO ₂
allyl	OH	OH	3	NO ₂
H	OH	OH	3	NO ₂
Me	OH	OH	3	NO ₂
benzyl	OH	OH	3	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	3	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	CN
allyl	OH	OH	3	CN
H	OH	OH	3	CN
Me	OH	OH	3	CN
benzyl	OH	OH	3	CN
2-phenethyl	OH	OH	3	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NCS
allyl	OH	OH	3	NCS
H	OH	OH	3	NCS
Me	OH	OH	3	NCS
benzyl	OH	OH	3	NCS
2-phenethyl	OH	OH	3	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOH
allyl	OH	OH	3	COOH
H	OH	OH	3	COOH
Me	OH	OH	3	COOH
benzyl	OH	OH	3	COOH
2-phenethyl	OH	OH	3	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOMe
allyl	OH	OH	3	COOMe
H	OH	OH	3	COOMe
Me	OH	OH	3	COOMe
benzyl	OH	OH	3	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	3	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOEt
allyl	OH	OH	3	COOEt
H	OH	OH	3	COOEt
Me	OH	OH	3	COOEt
benzyl	OH	OH	3	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	3	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCHO
allyl	OH	OH	3	NHCHO
H	OH	OH	3	NHCHO
Me	OH	OH	3	NHCHO
benzyl	OH	OH	3	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Me
allyl	OH	OH	3	NHCO-Me
H	OH	OH	3	NHCO-Me
Me	OH	OH	3	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	3	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-Me



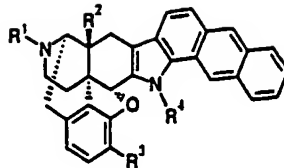
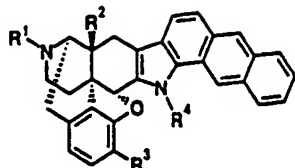
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
H	OH	OH	3	NHCO-Ph
Me	OH	OH	3	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
H	OH	OH	3	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	3	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
H	OH	OH	3	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	3	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OH
allyl	OH	OH	4	OH
H	OH	OH	4	OH
Me	OH	OH	4	OH
benzyl	OH	OH	4	OH
2-phenethyl	OH	OH	4	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OMe
allyl	OH	OH	4	OMe
H	OH	OH	4	OMe
Me	OH	OH	4	OMe
benzyl	OH	OH	4	OMe
2-phenethyl	OH	OH	4	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OEt
allyl	OH	OH	4	OEt
H	OH	OH	4	OEt
Me	OH	OH	4	OEt
benzyl	OH	OH	4	OEt
2-phenethyl	OH	OH	4	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NH ₂
allyl	OH	OH	4	NH ₂
H	OH	OH	4	NH ₂
Me	OH	OH	4	NH ₂
benzyl	OH	OH	4	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	4	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NO ₂
allyl	OH	OH	4	NO ₂
H	OH	OH	4	NO ₂
Me	OH	OH	4	NO ₂
benzyl	OH	OH	4	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	4	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	CN
allyl	OH	OH	4	CN
H	OH	OH	4	CN
Me	OH	OH	4	CN
benzyl	OH	OH	4	CN
2-phenethyl	OH	OH	4	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NCS
allyl	OH	OH	4	NCS
H	OH	OH	4	NCS
Me	OH	OH	4	NCS
benzyl	OH	OH	4	NCS
2-phenethyl	OH	OH	4	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOH
allyl	OH	OH	4	COOH
H	OH	OH	4	COOH
Me	OH	OH	4	COOH
benzyl	OH	OH	4	COOH
2-phenethyl	OH	OH	4	COOH



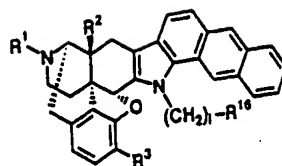
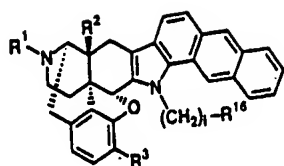
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOMe
allyl	OH	OH	4	COOMe
H	OH	OH	4	COOMe
Me	OH	OH	4	COOMe
benzyl	OH	OH	4	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	4	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOEt
allyl	OH	OH	4	COOEt
H	OH	OH	4	COOEt
Me	OH	OH	4	COOEt
benzyl	OH	OH	4	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	4	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCHO
allyl	OH	OH	4	NHCHO
H	OH	OH	4	NHCHO
Me	OH	OH	4	NHCHO
benzyl	OH	OH	4	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
allyl	OH	OH	4	NHCO-Me
H	OH	OH	4	NHCO-Me
Me	OH	OH	4	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	4	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
H	OH	OH	4	NHCO-Ph
Me	OH	OH	4	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
H	OH	OH	4	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	4	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
H	OH	OH	4	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	4	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	OH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	CN
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	OH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	CN
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHPh



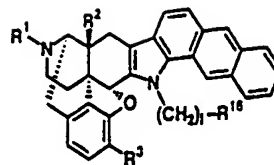
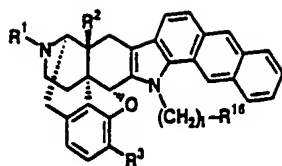
R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	H
cyclobutylmethyl	OH	OH	H
allyl	OH	OH	H
H	OH	OH	H
Me	OH	OH	H
benzyl	OH	OH	H
2-phenethyl	OH	OH	H
cyclopropylmethyl	OH	OH	Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	Me
allyl	OH	OH	Me
H	OH	OH	Me
Me	OH	OH	Me
benzyl	OH	OH	Me
2-phenethyl	OH	OH	Me
cyclopropylmethyl	OH	OH	Bu
cyclobutylmethyl	OH	OH	Bu
allyl	OH	OH	Bu
H	OH	OH	Bu
Me	OH	OH	Bu
benzyl	OH	OH	Bu
2-phenethyl	OH	OH	Bu
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhCH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhCH ₂
allyl	OH	OH	PhCH ₂
H	OH	OH	PhCH ₂
Me	OH	OH	PhCH ₂
benzyl	OH	OH	PhCH ₂
2-phenethyl	OH	OH	PhCH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂

R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
allyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
H	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
Me	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
benzyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
2-phenethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
cyclobutylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
allyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
H	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
Me	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
benzyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
2-phenethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhCO
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhCO
allyl	OH	OH	PhCO
H	OH	OH	PhCO
Me	OH	OH	PhCO
benzyl	OH	OH	PhCO
2-phenethyl	OH	OH	PhCO
cyclopropylmethyl	OH	OH	MeSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	MeSO ₂
allyl	OH	OH	MeSO ₂
H	OH	OH	MeSO ₂
Me	OH	OH	MeSO ₂
benzyl	OH	OH	MeSO ₂
2-phenethyl	OH	OH	MeSO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhSO ₂
allyl	OH	OH	PhSO ₂
H	OH	OH	PhSO ₂
Me	OH	OH	PhSO ₂
benzyl	OH	OH	PhSO ₂
2-phenethyl	OH	OH	PhSO ₂



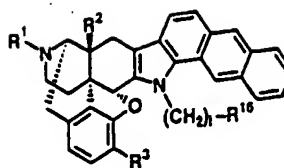
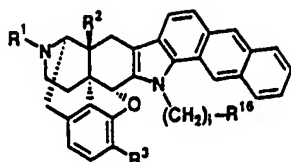
R¹	R²	R³	I	R¹⁵
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OH
allyl	OH	OH	2	OH
H	OH	OH	2	OH
Me	OH	OH	2	OH
benzyl	OH	OH	2	OH
2-phenethyl	OH	OH	2	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OMe
allyl	OH	OH	2	OMe
H	OH	OH	2	OMe
Me	OH	OH	2	OMe
benzyl	OH	OH	2	OMe
2-phenethyl	OH	OH	2	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OEt
allyl	OH	OH	2	OEt
H	OH	OH	2	OEt
Me	OH	OH	2	OEt
benzyl	OH	OH	2	OEt
2-phenethyl	OH	OH	2	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NH₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NH₂
allyl	OH	OH	2	NH₂
H	OH	OH	2	NH₂
Me	OH	OH	2	NH₂
benzyl	OH	OH	2	NH₂
2-phenethyl	OH	OH	2	NH₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NO₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NO₂
allyl	OH	OH	2	NO₂
H	OH	OH	2	NO₂
Me	OH	OH	2	NO₂
benzyl	OH	OH	2	NO₂
2-phenethyl	OH	OH	2	NO₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	CN
allyl	OH	OH	2	CN
H	OH	OH	2	CN
Me	OH	OH	2	CN
benzyl	OH	OH	2	CN
2-phenethyl	OH	OH	2	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NCS
allyl	OH	OH	2	NCS
H	OH	OH	2	NCS
Me	OH	OH	2	NCS
benzyl	OH	OH	2	NCS
2-phenethyl	OH	OH	2	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOH
allyl	OH	OH	2	COOH
H	OH	OH	2	COOH
Me	OH	OH	2	COOH
benzyl	OH	OH	2	COOH
2-phenethyl	OH	OH	2	COOH

R¹	R²	R³	I	R¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOMe
allyl	OH	OH	2	COOMe
H	OH	OH	2	COOMe
Me	OH	OH	2	COOMe
benzyl	OH	OH	2	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	2	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOEt
allyl	OH	OH	2	COOEt
H	OH	OH	2	COOEt
Me	OH	OH	2	COOEt
benzyl	OH	OH	2	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	2	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCHO
allyl	OH	OH	2	NHCHO
H	OH	OH	2	NHCHO
Me	OH	OH	2	NHCHO
benzyl	OH	OH	2	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
allyl	OH	OH	2	NHCO-Me
H	OH	OH	2	NHCO-Me
Me	OH	OH	2	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	2	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
H	OH	OH	2	NHCO-Ph
Me	OH	OH	2	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH₂)₃Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH₂)₃Ph
allyl	OH	OH	2	NHCO-(CH₂)₃Ph
H	OH	OH	2	NHCO-(CH₂)₃Ph
Me	OH	OH	2	NHCO-(CH₂)₃Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCO-(CH₂)₃Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH₂)₃Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF₃-cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF₃-cinnamyl)
allyl	OH	OH	2	NHCO-(CF₃-cinnamyl)
H	OH	OH	2	NHCO-(CF₃-cinnamyl)
Me	OH	OH	2	NHCO-(CF₃-cinnamyl)
benzyl	OH	OH	2	NHCO-(CF₃-cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF₃-cinnamyl)



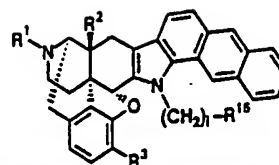
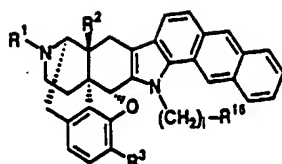
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
H	OH	OH	2	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	2	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
H	OH	OH	2	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	2	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OH
allyl	OH	OH	3	OH
H	OH	OH	3	OH
Me	OH	OH	3	OH
benzyl	OH	OH	3	OH
2-phenethyl	OH	OH	3	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OMe
allyl	OH	OH	3	OMe
H	OH	OH	3	OMe
Me	OH	OH	3	OMe
benzyl	OH	OH	3	OMe
2-phenethyl	OH	OH	3	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OEt
allyl	OH	OH	3	OEt
H	OH	OH	3	OEt
Me	OH	OH	3	OEt
benzyl	OH	OH	3	OEt
2-phenethyl	OH	OH	3	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NH ₂
allyl	OH	OH	3	NH ₂
H	OH	OH	3	NH ₂
Me	OH	OH	3	NH ₂
benzyl	OH	OH	3	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	3	NH ₂

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NO ₂
allyl	OH	OH	3	NO ₂
H	OH	OH	3	NO ₂
Me	OH	OH	3	NO ₂
benzyl	OH	OH	3	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	3	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	CN
allyl	OH	OH	3	CN
H	OH	OH	3	CN
Me	OH	OH	3	CN
benzyl	OH	OH	3	CN
2-phenethyl	OH	OH	3	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NCS
allyl	OH	OH	3	NCS
H	OH	OH	3	NCS
Me	OH	OH	3	NCS
benzyl	OH	OH	3	NCS
2-phenethyl	OH	OH	3	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOH
allyl	OH	OH	3	COOH
H	OH	OH	3	COOH
Me	OH	OH	3	COOH
benzyl	OH	OH	3	COOH
2-phenethyl	OH	OH	3	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOMe
allyl	OH	OH	3	COOMe
H	OH	OH	3	COOMe
Me	OH	OH	3	COOMe
benzyl	OH	OH	3	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	3	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOEt
allyl	OH	OH	3	COOEt
H	OH	OH	3	COOEt
Me	OH	OH	3	COOEt
benzyl	OH	OH	3	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	3	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCHO
allyl	OH	OH	3	NHCHO
H	OH	OH	3	NHCHO
Me	OH	OH	3	NHCHO
benzyl	OH	OH	3	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Me
allyl	OH	OH	3	NHCO-Me
H	OH	OH	3	NHCO-Me
Me	OH	OH	3	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	3	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-Me



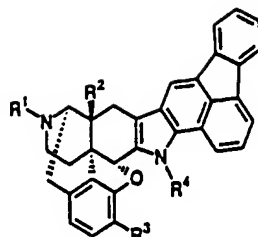
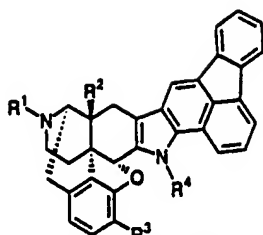
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
H	OH	OH	3	NHCO-Ph
Me	OH	OH	3	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₄ -Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₄ -Ph
allyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₄ -Ph
H	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₄ -Ph
Me	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₄ -Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₄ -Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₄ -Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
H	OH	OH	3	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	3	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
H	OH	OH	3	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	3	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ -Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ -Ph
allyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ -Ph
H	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ -Ph
Me	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ -Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ -Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ -Ph

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OH
allyl	OH	OH	4	OH
H	OH	OH	4	OH
Me	OH	OH	4	OH
benzyl	OH	OH	4	OH
2-phenethyl	OH	OH	4	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OMe
allyl	OH	OH	4	OMe
H	OH	OH	4	OMe
Me	OH	OH	4	OMe
benzyl	OH	OH	4	OMe
2-phenethyl	OH	OH	4	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OEt
allyl	OH	OH	4	OEt
H	OH	OH	4	OEt
Me	OH	OH	4	OEt
benzyl	OH	OH	4	OEt
2-phenethyl	OH	OH	4	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NH ₂
allyl	OH	OH	4	NH ₂
H	OH	OH	4	NH ₂
Me	OH	OH	4	NH ₂
benzyl	OH	OH	4	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	4	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NO ₂
allyl	OH	OH	4	NO ₂
H	OH	OH	4	NO ₂
Me	OH	OH	4	NO ₂
benzyl	OH	OH	4	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	4	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	CN
allyl	OH	OH	4	CN
H	OH	OH	4	CN
Me	OH	OH	4	CN
benzyl	OH	OH	4	CN
2-phenethyl	OH	OH	4	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NCS
allyl	OH	OH	4	NCS
H	OH	OH	4	NCS
Me	OH	OH	4	NCS
benzyl	OH	OH	4	NCS
2-phenethyl	OH	OH	4	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOH
allyl	OH	OH	4	COOH
H	OH	OH	4	COOH
Me	OH	OH	4	COOH
benzyl	OH	OH	4	COOH
2-phenethyl	OH	OH	4	COOH



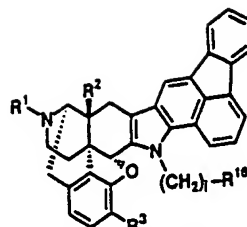
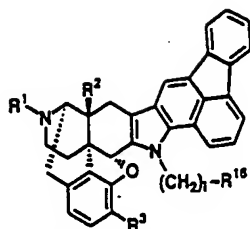
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁵
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOMe
allyl	OH	OH	4	COOMe
H	OH	OH	4	COOMe
Me	OH	OH	4	COOMe
benzyl	OH	OH	4	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	4	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOEt
allyl	OH	OH	4	COOEt
H	OH	OH	4	COOEt
Me	OH	OH	4	COOEt
benzyl	OH	OH	4	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	4	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCHO
allyl	OH	OH	4	NHCHO
H	OH	OH	4	NHCHO
Me	OH	OH	4	NHCHO
benzyl	OH	OH	4	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
allyl	OH	OH	4	NHCO-Me
H	OH	OH	4	NHCO-Me
Me	OH	OH	4	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	4	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
H	OH	OH	4	NHCO-Ph
Me	OH	OH	4	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁵
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
H	OH	OH	4	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	4	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
H	OH	OH	4	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	4	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	OH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	CN
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	OH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	CN
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHPh



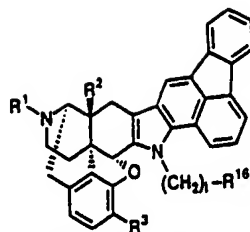
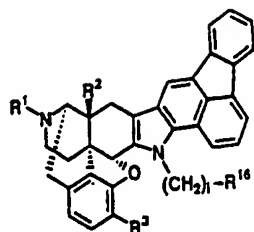
R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	H
cyclobutylmethyl	OH	OH	H
allyl	OH	OH	H
H	OH	OH	H
Me	OH	OH	H
benzyl	OH	OH	H
2-phenethyl	OH	OH	H
cyclopropylmethyl	OH	OH	Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	Me
allyl	OH	OH	Me
H	OH	OH	Me
Me	OH	OH	Me
benzyl	OH	OH	Me
2-phenethyl	OH	OH	Me
cyclopropylmethyl	OH	OH	Bu
cyclobutylmethyl	OH	OH	Bu
allyl	OH	OH	Bu
H	OH	OH	Bu
Me	OH	OH	Bu
benzyl	OH	OH	Bu
2-phenethyl	OH	OH	Bu
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhCH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhCH ₂
allyl	OH	OH	PhCH ₂
H	OH	OH	PhCH ₂
Me	OH	OH	PhCH ₂
benzyl	OH	OH	PhCH ₂
2-phenethyl	OH	OH	PhCH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂

R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
allyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
H	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
Me	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
benzyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
2-phenethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
allyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
H	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
Me	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
benzyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
2-phenethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhCO
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhCO
allyl	OH	OH	PhCO
H	OH	OH	PhCO
Me	OH	OH	PhCO
benzyl	OH	OH	PhCO
2-phenethyl	OH	OH	PhCO
cyclopropylmethyl	OH	OH	MeSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	MeSO ₂
allyl	OH	OH	MeSO ₂
H	OH	OH	MeSO ₂
Me	OH	OH	MeSO ₂
benzyl	OH	OH	MeSO ₂
2-phenethyl	OH	OH	MeSO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhSO ₂
allyl	OH	OH	PhSO ₂
H	OH	OH	PhSO ₂
Me	OH	OH	PhSO ₂
benzyl	OH	OH	PhSO ₂
2-phenethyl	OH	OH	PhSO ₂



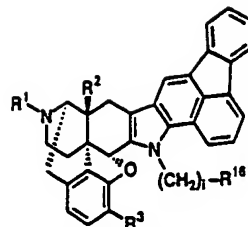
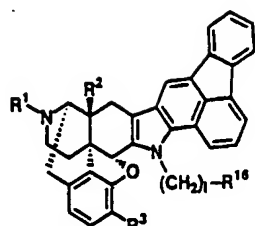
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OH
allyl	OH	OH	2	OH
H	OH	OH	2	OH
Me	OH	OH	2	OH
benzyl	OH	OH	2	OH
2-phenethyl	OH	OH	2	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OMe
allyl	OH	OH	2	OMe
H	OH	OH	2	OMe
Me	OH	OH	2	OMe
benzyl	OH	OH	2	OMe
2-phenethyl	OH	OH	2	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OEi
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OEi
allyl	OH	OH	2	OEi
H	OH	OH	2	OEi
Me	OH	OH	2	OEi
benzyl	OH	OH	2	OEi
2-phenethyl	OH	OH	2	OEi
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NH ₂
allyl	OH	OH	2	NH ₂
H	OH	OH	2	NH ₂
Me	OH	OH	2	NH ₂
benzyl	OH	OH	2	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	2	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NO ₂
allyl	OH	OH	2	NO ₂
H	OH	OH	2	NO ₂
Me	OH	OH	2	NO ₂
benzyl	OH	OH	2	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	2	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	CN
allyl	OH	OH	2	CN
H	OH	OH	2	CN
Me	OH	OH	2	CN
benzyl	OH	OH	2	CN
2-phenethyl	OH	OH	2	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NCS
allyl	OH	OH	2	NCS
H	OH	OH	2	NCS
Me	OH	OH	2	NCS
benzyl	OH	OH	2	NCS
2-phenethyl	OH	OH	2	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOH
allyl	OH	OH	2	COOH
H	OH	OH	2	COOH
Me	OH	OH	2	COOH
benzyl	OH	OH	2	COOH
2-phenethyl	OH	OH	2	COOH

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOMe
allyl	OH	OH	2	COOMe
H	OH	OH	2	COOMe
Me	OH	OH	2	COOMe
benzyl	OH	OH	2	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	2	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOEt
allyl	OH	OH	2	COOEt
H	OH	OH	2	COOEt
Me	OH	OH	2	COOEt
benzyl	OH	OH	2	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	2	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCHO
allyl	OH	OH	2	NHCHO
H	OH	OH	2	NHCHO
Me	OH	OH	2	NHCHO
benzyl	OH	OH	2	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
allyl	OH	OH	2	NHCO-Me
H	OH	OH	2	NHCO-Me
Me	OH	OH	2	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	2	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
H	OH	OH	2	NHCO-Ph
Me	OH	OH	2	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)



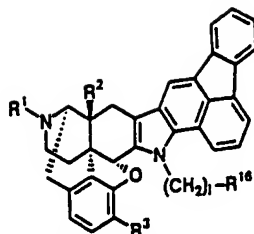
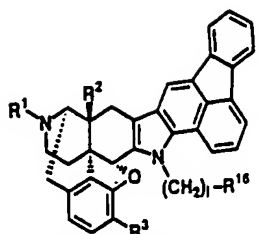
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
H	OH	OH	2	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	2	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
H	OH	OH	2	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	2	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OH
allyl	OH	OH	3	OH
H	OH	OH	3	OH
Me	OH	OH	3	OH
benzyl	OH	OH	3	OH
2-phenethyl	OH	OH	3	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OMe
allyl	OH	OH	3	OMe
H	OH	OH	3	OMe
Me	OH	OH	3	OMe
benzyl	OH	OH	3	OMe
2-phenethyl	OH	OH	3	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OEt
allyl	OH	OH	3	OEt
H	OH	OH	3	OEt
Me	OH	OH	3	OEt
benzyl	OH	OH	3	OEt
2-phenethyl	OH	OH	3	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NH ₂
allyl	OH	OH	3	NH ₂
H	OH	OH	3	NH ₂
Me	OH	OH	3	NH ₂
benzyl	OH	OH	3	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	3	NH ₂

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NO ₂
allyl	OH	OH	3	NO ₂
H	OH	OH	3	NO ₂
Me	OH	OH	3	NO ₂
benzyl	OH	OH	3	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	3	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	CN
allyl	OH	OH	3	CN
H	OH	OH	3	CN
Me	OH	OH	3	CN
benzyl	OH	OH	3	CN
2-phenethyl	OH	OH	3	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NCS
allyl	OH	OH	3	NCS
H	OH	OH	3	NCS
Me	OH	OH	3	NCS
benzyl	OH	OH	3	NCS
2-phenethyl	OH	OH	3	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOH
allyl	OH	OH	3	COOH
H	OH	OH	3	COOH
Me	OH	OH	3	COOH
benzyl	OH	OH	3	COOH
2-phenethyl	OH	OH	3	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOMe
allyl	OH	OH	3	COOMe
H	OH	OH	3	COOMe
Me	OH	OH	3	COOMe
benzyl	OH	OH	3	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	3	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOEt
allyl	OH	OH	3	COOEt
H	OH	OH	3	COOEt
Me	OH	OH	3	COOEt
benzyl	OH	OH	3	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	3	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCHO
allyl	OH	OH	3	NHCHO
H	OH	OH	3	NHCHO
Me	OH	OH	3	NHCHO
benzyl	OH	OH	3	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Me
allyl	OH	OH	3	NHCO-Me
H	OH	OH	3	NHCO-Me
Me	OH	OH	3	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	3	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-Me



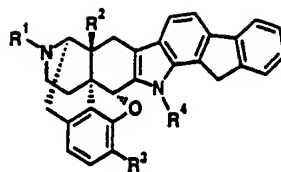
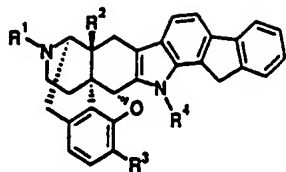
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
H	OH	OH	3	NHCO-Ph
Me	OH	OH	3	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₄ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₄ Ph
allyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₄ Ph
H	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₄ Ph
Me	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₄ Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₄ Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₄ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
H	OH	OH	3	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	3	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
H	OH	OH	3	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	3	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OH
allyl	OH	OH	4	OH
H	OH	OH	4	OH
Me	OH	OH	4	OH
benzyl	OH	OH	4	OH
2-phenethyl	OH	OH	4	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OMe
allyl	OH	OH	4	OMe
H	OH	OH	4	OMe
Me	OH	OH	4	OMe
benzyl	OH	OH	4	OMe
2-phenethyl	OH	OH	4	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OEt
allyl	OH	OH	4	OEt
H	OH	OH	4	OEt
Me	OH	OH	4	OEt
benzyl	OH	OH	4	OEt
2-phenethyl	OH	OH	4	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NH ₂
allyl	OH	OH	4	NH ₂
H	OH	OH	4	NH ₂
Me	OH	OH	4	NH ₂
benzyl	OH	OH	4	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	4	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NO ₂
allyl	OH	OH	4	NO ₂
H	OH	OH	4	NO ₂
Me	OH	OH	4	NO ₂
benzyl	OH	OH	4	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	4	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	CN
allyl	OH	OH	4	CN
H	OH	OH	4	CN
Me	OH	OH	4	CN
benzyl	OH	OH	4	CN
2-phenethyl	OH	OH	4	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NCS
allyl	OH	OH	4	NCS
H	OH	OH	4	NCS
Me	OH	OH	4	NCS
benzyl	OH	OH	4	NCS
2-phenethyl	OH	OH	4	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOH
allyl	OH	OH	4	COOH
H	OH	OH	4	COOH
Me	OH	OH	4	COOH
benzyl	OH	OH	4	COOH
2-phenethyl	OH	OH	4	COOH



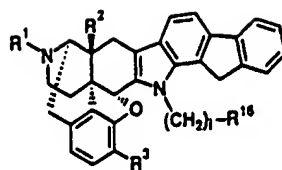
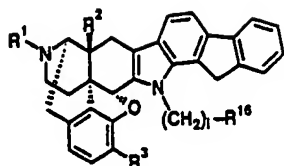
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOMe
allyl	OH	OH	4	COOMe
H	OH	OH	4	COOMe
Me	OH	OH	4	COOMe
benzyl	OH	OH	4	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	4	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOEt
allyl	OH	OH	4	COOEt
H	OH	OH	4	COOEt
Me	OH	OH	4	COOEt
benzyl	OH	OH	4	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	4	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCHO
allyl	OH	OH	4	NHCHO
H	OH	OH	4	NHCHO
Me	OH	OH	4	NHCHO
benzyl	OH	OH	4	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
allyl	OH	OH	4	NHCO-Me
H	OH	OH	4	NHCO-Me
Me	OH	OH	4	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	4	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
H	OH	OH	4	NHCO-Ph
Me	OH	OH	4	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
H	OH	OH	4	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	4	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
H	OH	OH	4	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	4	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	OH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	CN
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	OH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	CN
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHPh



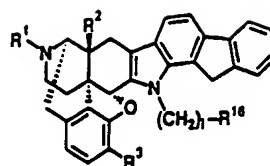
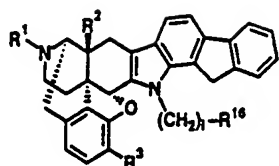
R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	H
cyclobutylmethyl	OH	OH	H
allyl	OH	OH	H
H	OH	OH	H
Me	OH	OH	H
benzyl	OH	OH	H
2-phenethyl	OH	OH	H
cyclopropylmethyl	OH	OH	Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	Me
allyl	OH	OH	Me
H	OH	OH	Me
Me	OH	OH	Me
benzyl	OH	OH	Me
2-phenethyl	OH	OH	Me
cyclopropylmethyl	OH	OH	Bu
cyclobutylmethyl	OH	OH	Bu
allyl	OH	OH	Bu
H	OH	OH	Bu
Me	OH	OH	Bu
benzyl	OH	OH	Bu
2-phenethyl	OH	OH	Bu
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhCH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhCH ₂
allyl	OH	OH	PhCH ₂
H	OH	OH	PhCH ₂
Me	OH	OH	PhCH ₂
benzyl	OH	OH	PhCH ₂
2-phenethyl	OH	OH	PhCH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂

R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
allyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
H	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
Me	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
benzyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
2-phenethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
cyclobutylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
allyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
H	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
Me	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
benzyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
2-phenethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhCO
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhCO
allyl	OH	OH	PhCO
H	OH	OH	PhCO
Me	OH	OH	PhCO
benzyl	OH	OH	PhCO
2-phenethyl	OH	OH	PhCO
cyclopropylmethyl	OH	OH	MeSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	MeSO ₂
allyl	OH	OH	MeSO ₂
H	OH	OH	MeSO ₂
Me	OH	OH	MeSO ₂
benzyl	OH	OH	MeSO ₂
2-phenethyl	OH	OH	MeSO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhSO ₂
allyl	OH	OH	PhSO ₂
H	OH	OH	PhSO ₂
Me	OH	OH	PhSO ₂
benzyl	OH	OH	PhSO ₂
2-phenethyl	OH	OH	PhSO ₂



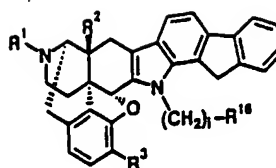
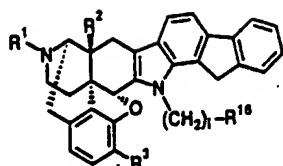
R ¹	R ²	R ³	l	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OH
allyl	OH	OH	2	OH
H	OH	OH	2	OH
Me	OH	OH	2	OH
benzyl	OH	OH	2	OH
2-phenethyl	OH	OH	2	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OMe
allyl	OH	OH	2	OMe
H	OH	OH	2	OMe
Me	OH	OH	2	OMe
benzyl	OH	OH	2	OMe
2-phenethyl	OH	OH	2	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OEt
allyl	OH	OH	2	OEt
H	OH	OH	2	OEt
Me	OH	OH	2	OEt
benzyl	OH	OH	2	OEt
2-phenethyl	OH	OH	2	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NH ₂
allyl	OH	OH	2	NH ₂
H	OH	OH	2	NH ₂
Me	OH	OH	2	NH ₂
benzyl	OH	OH	2	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	2	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NO ₂
allyl	OH	OH	2	NO ₂
H	OH	OH	2	NO ₂
Me	OH	OH	2	NO ₂
benzyl	OH	OH	2	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	2	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	CN
allyl	OH	OH	2	CN
H	OH	OH	2	CN
Me	OH	OH	2	CN
benzyl	OH	OH	2	CN
2-phenethyl	OH	OH	2	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NCS
allyl	OH	OH	2	NCS
H	OH	OH	2	NCS
Me	OH	OH	2	NCS
benzyl	OH	OH	2	NCS
2-phenethyl	OH	OH	2	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOH
allyl	OH	OH	2	COOH
H	OH	OH	2	COOH
Me	OH	OH	2	COOH
benzyl	OH	OH	2	COOH
2-phenethyl	OH	OH	2	COOH

R ¹	R ²	R ³	l	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOMe
allyl	OH	OH	2	COOMe
H	OH	OH	2	COOMe
Me	OH	OH	2	COOMe
benzyl	OH	OH	2	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	2	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOEt
allyl	OH	OH	2	COOEt
H	OH	OH	2	COOEt
Me	OH	OH	2	COOEt
benzyl	OH	OH	2	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	2	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCHO
allyl	OH	OH	2	NHCHO
H	OH	OH	2	NHCHO
Me	OH	OH	2	NHCHO
benzyl	OH	OH	2	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
allyl	OH	OH	2	NHCO-Me
H	OH	OH	2	NHCO-Me
Me	OH	OH	2	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	2	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
H	OH	OH	2	NHCO-Ph
Me	OH	OH	2	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)



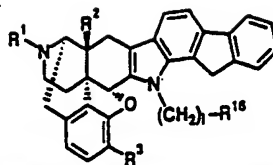
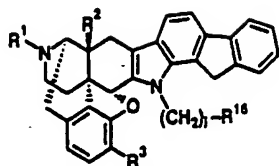
R¹	R²	R³	i	R¹⁵
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
H	OH	OH	2	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	2	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
H	OH	OH	2	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	2	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH₂Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH₂Ph
allyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH₂Ph
H	OH	OH	2	NHCS-NHCH₂Ph
Me	OH	OH	2	NHCS-NHCH₂Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH₂Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH₂Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OH
allyl	OH	OH	3	OH
H	OH	OH	3	OH
Me	OH	OH	3	OH
benzyl	OH	OH	3	OH
2-phenethyl	OH	OH	3	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OMe
allyl	OH	OH	3	OMe
H	OH	OH	3	OMe
Me	OH	OH	3	OMe
benzyl	OH	OH	3	OMe
2-phenethyl	OH	OH	3	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OEt
allyl	OH	OH	3	OEt
H	OH	OH	3	OEt
Me	OH	OH	3	OEt
benzyl	OH	OH	3	OEt
2-phenethyl	OH	OH	3	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NH₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NH₂
allyl	OH	OH	3	NH₂
H	OH	OH	3	NH₂
Me	OH	OH	3	NH₂
benzyl	OH	OH	3	NH₂
2-phenethyl	OH	OH	3	NH₂

R¹	R²	R³	i	R¹⁵
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NO₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NO₂
allyl	OH	OH	3	NO₂
H	OH	OH	3	NO₂
Me	OH	OH	3	NO₂
benzyl	OH	OH	3	NO₂
2-phenethyl	OH	OH	3	NO₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	CN
allyl	OH	OH	3	CN
H	OH	OH	3	CN
Me	OH	OH	3	CN
benzyl	OH	OH	3	CN
2-phenethyl	OH	OH	3	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NCS
allyl	OH	OH	3	NCS
H	OH	OH	3	NCS
Me	OH	OH	3	NCS
benzyl	OH	OH	3	NCS
2-phenethyl	OH	OH	3	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOH
allyl	OH	OH	3	COOH
H	OH	OH	3	COOH
Me	OH	OH	3	COOH
benzyl	OH	OH	3	COOH
2-phenethyl	OH	OH	3	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOMe
allyl	OH	OH	3	COOMe
H	OH	OH	3	COOMe
Me	OH	OH	3	COOMe
benzyl	OH	OH	3	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	3	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOEt
allyl	OH	OH	3	COOEt
H	OH	OH	3	COOEt
Me	OH	OH	3	COOEt
benzyl	OH	OH	3	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	3	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCHO
allyl	OH	OH	3	NHCHO
H	OH	OH	3	NHCHO
Me	OH	OH	3	NHCHO
benzyl	OH	OH	3	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Me
allyl	OH	OH	3	NHCO-Me
H	OH	OH	3	NHCO-Me
Me	OH	OH	3	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	3	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-Me



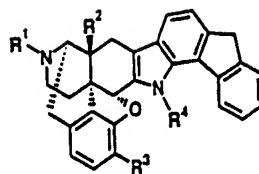
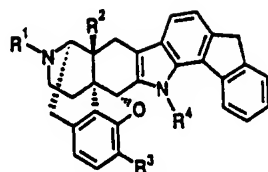
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁸
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
H	OH	OH	3	NHCO-Ph
Me	OH	OH	3	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
allyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
H	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
Me	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
H	OH	OH	3	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	3	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
H	OH	OH	3	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	3	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁸
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OH
allyl	OH	OH	4	OH
H	OH	OH	4	OH
Me	OH	OH	4	OH
benzyl	OH	OH	4	OH
2-phenethyl	OH	OH	4	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OMe
allyl	OH	OH	4	OMe
H	OH	OH	4	OMe
Me	OH	OH	4	OMe
benzyl	OH	OH	4	OMe
2-phenethyl	OH	OH	4	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OEt
allyl	OH	OH	4	OEt
H	OH	OH	4	OEt
Me	OH	OH	4	OEt
benzyl	OH	OH	4	OEt
2-phenethyl	OH	OH	4	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NH ₂
allyl	OH	OH	4	NH ₂
H	OH	OH	4	NH ₂
Me	OH	OH	4	NH ₂
benzyl	OH	OH	4	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	4	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NO ₂
allyl	OH	OH	4	NO ₂
H	OH	OH	4	NO ₂
Me	OH	OH	4	NO ₂
benzyl	OH	OH	4	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	4	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	CN
allyl	OH	OH	4	CN
H	OH	OH	4	CN
Me	OH	OH	4	CN
benzyl	OH	OH	4	CN
2-phenethyl	OH	OH	4	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NCS
allyl	OH	OH	4	NCS
H	OH	OH	4	NCS
Me	OH	OH	4	NCS
benzyl	OH	OH	4	NCS
2-phenethyl	OH	OH	4	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOH
allyl	OH	OH	4	COOH
H	OH	OH	4	COOH
Me	OH	OH	4	COOH
benzyl	OH	OH	4	COOH
2-phenethyl	OH	OH	4	COOH



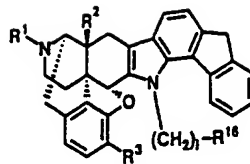
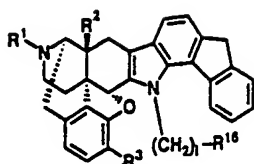
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁸
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOMe
allyl	OH	OH	4	COOMe
H	OH	OH	4	COOMe
Me	OH	OH	4	COOMe
benzyl	OH	OH	4	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	4	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOEt
allyl	OH	OH	4	COOEt
H	OH	OH	4	COOEt
Me	OH	OH	4	COOEt
benzyl	OH	OH	4	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	4	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCHO
allyl	OH	OH	4	NHCHO
H	OH	OH	4	NHCHO
Me	OH	OH	4	NHCHO
benzyl	OH	OH	4	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
allyl	OH	OH	4	NHCO-Me
H	OH	OH	4	NHCO-Me
Me	OH	OH	4	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	4	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
H	OH	OH	4	NHCO-Ph
Me	OH	OH	4	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁸
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
H	OH	OH	4	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	4	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
H	OH	OH	4	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	4	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	OH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	CN
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	OH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	CN
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHPh



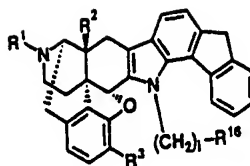
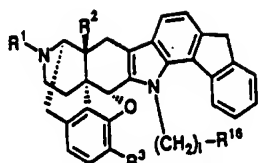
R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	H
cyclobutylmethyl	OH	OH	H
allyl	OH	OH	H
H	OH	OH	H
Me	OH	OH	H
benzyl	OH	OH	H
2-phenethyl	OH	OH	H
cyclopropylmethyl	OH	OH	Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	Me
allyl	OH	OH	Me
H	OH	OH	Me
Me	OH	OH	Me
benzyl	OH	OH	Me
2-phenethyl	OH	OH	Me
cyclopropylmethyl	OH	OH	Bu
cyclobutylmethyl	OH	OH	Bu
allyl	OH	OH	Bu
H	OH	OH	Bu
Me	OH	OH	Bu
benzyl	OH	OH	Bu
2-phenethyl	OH	OH	Bu
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhCH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhCH ₂
allyl	OH	OH	PhCH ₂
H	OH	OH	PhCH ₂
Me	OH	OH	PhCH ₂
benzyl	OH	OH	PhCH ₂
2-phenethyl	OH	OH	PhCH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂

R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
allyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
H	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
Me	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
benzyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
2-phenethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
cyclobutylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
allyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
H	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
Me	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
benzyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
2-phenethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhCO
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhCO
allyl	OH	OH	PhCO
H	OH	OH	PhCO
Me	OH	OH	PhCO
benzyl	OH	OH	PhCO
2-phenethyl	OH	OH	PhCO
cyclopropylmethyl	OH	OH	MeSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	MeSO ₂
allyl	OH	OH	MeSO ₂
H	OH	OH	MeSO ₂
Me	OH	OH	MeSO ₂
benzyl	OH	OH	MeSO ₂
2-phenethyl	OH	OH	MeSO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhSO ₂
allyl	OH	OH	PhSO ₂
H	OH	OH	PhSO ₂
Me	OH	OH	PhSO ₂
benzyl	OH	OH	PhSO ₂
2-phenethyl	OH	OH	PhSO ₂



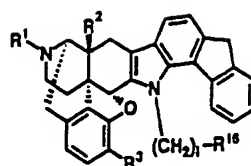
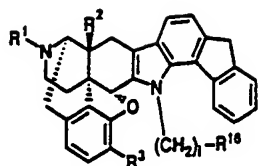
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁸
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OH
allyl	OH	OH	2	OH
H	OH	OH	2	OH
Me	OH	OH	2	OH
benzyl	OH	OH	2	OH
2-phenethyl	OH	OH	2	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OMe
allyl	OH	OH	2	OMe
H	OH	OH	2	OMe
Me	OH	OH	2	OMe
benzyl	OH	OH	2	OMe
2-phenethyl	OH	OH	2	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OEt
allyl	OH	OH	2	OEt
H	OH	OH	2	OEt
Me	OH	OH	2	OEt
benzyl	OH	OH	2	OEt
2-phenethyl	OH	OH	2	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NH ₂
allyl	OH	OH	2	NH ₂
H	OH	OH	2	NH ₂
Me	OH	OH	2	NH ₂
benzyl	OH	OH	2	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	2	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NO ₂
allyl	OH	OH	2	NO ₂
H	OH	OH	2	NO ₂
Me	OH	OH	2	NO ₂
benzyl	OH	OH	2	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	2	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	CN
allyl	OH	OH	2	CN
H	OH	OH	2	CN
Me	OH	OH	2	CN
benzyl	OH	OH	2	CN
2-phenethyl	OH	OH	2	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NCS
allyl	OH	OH	2	NCS
H	OH	OH	2	NCS
Me	OH	OH	2	NCS
benzyl	OH	OH	2	NCS
2-phenethyl	OH	OH	2	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOH
allyl	OH	OH	2	COOH
H	OH	OH	2	COOH
Me	OH	OH	2	COOH
benzyl	OH	OH	2	COOH
2-phenethyl	OH	OH	2	COOH

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁸
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOMe
allyl	OH	OH	2	COOMe
H	OH	OH	2	COOMe
Me	OH	OH	2	COOMe
benzyl	OH	OH	2	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	2	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOEt
allyl	OH	OH	2	COOEt
H	OH	OH	2	COOEt
Me	OH	OH	2	COOEt
benzyl	OH	OH	2	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	2	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCHO
allyl	OH	OH	2	NHCHO
H	OH	OH	2	NHCHO
Me	OH	OH	2	NHCHO
benzyl	OH	OH	2	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
allyl	OH	OH	2	NHCO-Me
H	OH	OH	2	NHCO-Me
Me	OH	OH	2	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	2	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
H	OH	OH	2	NHCO-Ph
Me	OH	OH	2	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
allyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
H	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
Me	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)



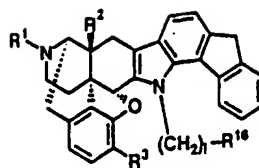
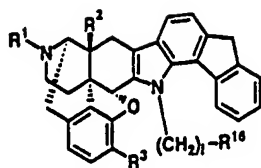
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
H	OH	OH	2	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	2	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
H	OH	OH	2	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	2	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OH
allyl	OH	OH	3	OH
H	OH	OH	3	OH
Me	OH	OH	3	OH
benzyl	OH	OH	3	OH
2-phenethyl	OH	OH	3	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OMe
allyl	OH	OH	3	OMe
H	OH	OH	3	OMe
Me	OH	OH	3	OMe
benzyl	OH	OH	3	OMe
2-phenethyl	OH	OH	3	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OEt
allyl	OH	OH	3	OEt
H	OH	OH	3	OEt
Me	OH	OH	3	OEt
benzyl	OH	OH	3	OEt
2-phenethyl	OH	OH	3	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NH ₂
allyl	OH	OH	3	NH ₂
H	OH	OH	3	NH ₂
Me	OH	OH	3	NH ₂
benzyl	OH	OH	3	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	3	NH ₂

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NO ₂
allyl	OH	OH	3	NO ₂
H	OH	OH	3	NO ₂
Me	OH	OH	3	NO ₂
benzyl	OH	OH	3	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	3	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	CN
allyl	OH	OH	3	CN
H	OH	OH	3	CN
Me	OH	OH	3	CN
benzyl	OH	OH	3	CN
2-phenethyl	OH	OH	3	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NCS
allyl	OH	OH	3	NCS
H	OH	OH	3	NCS
Me	OH	OH	3	NCS
benzyl	OH	OH	3	NCS
2-phenethyl	OH	OH	3	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOH
allyl	OH	OH	3	COOH
H	OH	OH	3	COOH
Me	OH	OH	3	COOH
benzyl	OH	OH	3	COOH
2-phenethyl	OH	OH	3	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOMe
allyl	OH	OH	3	COOMe
H	OH	OH	3	COOMe
Me	OH	OH	3	COOMe
benzyl	OH	OH	3	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	3	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOEt
allyl	OH	OH	3	COOEt
H	OH	OH	3	COOEt
Me	OH	OH	3	COOEt
benzyl	OH	OH	3	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	3	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCHO
allyl	OH	OH	3	NHCHO
H	OH	OH	3	NHCHO
Me	OH	OH	3	NHCHO
benzyl	OH	OH	3	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Me
allyl	OH	OH	3	NHCO-Me
H	OH	OH	3	NHCO-Me
Me	OH	OH	3	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	3	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-Me



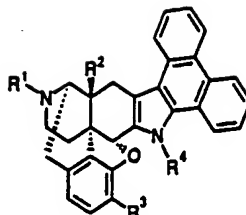
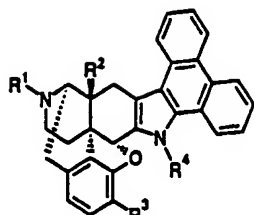
R ¹	R ²	R ³	i	R ¹⁸
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
H	OH	OH	3	NHCO-Ph
Me	OH	OH	3	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
H	OH	OH	3	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	3	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
H	OH	OH	3	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	3	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph

R ¹	R ²	R ³	i	R ¹⁸
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OH
allyl	OH	OH	4	OH
H	OH	OH	4	OH
Me	OH	OH	4	OH
benzyl	OH	OH	4	OH
2-phenethyl	OH	OH	4	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OMe
allyl	OH	OH	4	OMe
H	OH	OH	4	OMe
Me	OH	OH	4	OMe
benzyl	OH	OH	4	OMe
2-phenethyl	OH	OH	4	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OEt
allyl	OH	OH	4	OEt
H	OH	OH	4	OEt
Me	OH	OH	4	OEt
benzyl	OH	OH	4	OEt
2-phenethyl	OH	OH	4	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NH ₂
allyl	OH	OH	4	NH ₂
H	OH	OH	4	NH ₂
Me	OH	OH	4	NH ₂
benzyl	OH	OH	4	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	4	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NO ₂
allyl	OH	OH	4	NO ₂
H	OH	OH	4	NO ₂
Me	OH	OH	4	NO ₂
benzyl	OH	OH	4	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	4	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	CN
allyl	OH	OH	4	CN
H	OH	OH	4	CN
Me	OH	OH	4	CN
benzyl	OH	OH	4	CN
2-phenethyl	OH	OH	4	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NCS
allyl	OH	OH	4	NCS
H	OH	OH	4	NCS
Me	OH	OH	4	NCS
benzyl	OH	OH	4	NCS
2-phenethyl	OH	OH	4	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOH
allyl	OH	OH	4	COOH
H	OH	OH	4	COOH
Me	OH	OH	4	COOH
benzyl	OH	OH	4	COOH
2-phenethyl	OH	OH	4	COOH



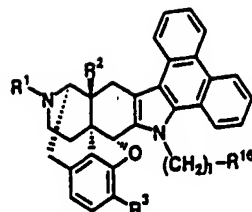
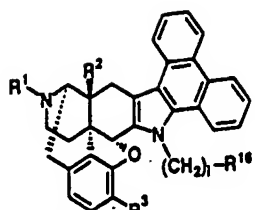
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOMe
allyl	OH	OH	4	COOMe
H	OH	OH	4	COOMe
Me	OH	OH	4	COOMe
benzyl	OH	OH	4	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	4	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOEt
allyl	OH	OH	4	COOEt
H	OH	OH	4	COOEt
Me	OH	OH	4	COOEt
benzyl	OH	OH	4	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	4	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCHO
allyl	OH	OH	4	NHCHO
H	OH	OH	4	NHCHO
Me	OH	OH	4	NHCHO
benzyl	OH	OH	4	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
allyl	OH	OH	4	NHCO-Me
H	OH	OH	4	NHCO-Me
Me	OH	OH	4	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	4	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
H	OH	OH	4	NHCO-Ph
Me	OH	OH	4	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
H	OH	OH	4	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	4	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
H	OH	OH	4	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	4	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	OH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	CN
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	OH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	CN
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHPh



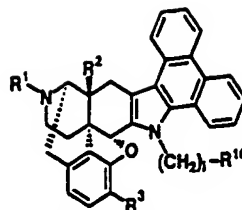
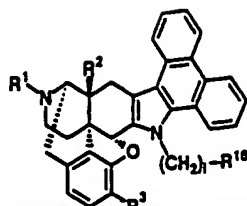
R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	H
cyclobutylmethyl	OH	OH	H
allyl	OH	OH	H
H	OH	OH	H
Me	OH	OH	H
benzyl	OH	OH	H
2-phenethyl	OH	OH	H
cyclopropylmethyl	OH	OH	Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	Me
allyl	OH	OH	Me
H	OH	OH	Me
Me	OH	OH	Me
benzyl	OH	OH	Me
2-phenethyl	OH	OH	Me
cyclopropylmethyl	OH	OH	Bu
cyclobutylmethyl	OH	OH	Bu
allyl	OH	OH	Bu
H	OH	OH	Bu
Me	OH	OH	Bu
benzyl	OH	OH	Bu
2-phenethyl	OH	OH	Bu
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhCH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhCH ₂
allyl	OH	OH	PhCH ₂
H	OH	OH	PhCH ₂
Me	OH	OH	PhCH ₂
benzyl	OH	OH	PhCH ₂
2-phenethyl	OH	OH	PhCH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(F-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Cl-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Br-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(Me-C ₆ H ₄)CH ₂

R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyclopropylmethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(MeO-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(F ₃ C-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
allyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
H	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
Me	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
benzyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
2-phenethyl	OH	OH	(O ₂ N-C ₆ H ₄)CH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
allyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
H	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
Me	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
benzyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
2-phenethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
cyclobutylmethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
allyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
H	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
Me	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
benzyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
2-phenethyl	OH	OH	Ph(CH ₂) ₃
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhCO
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhCO
allyl	OH	OH	PhCO
H	OH	OH	PhCO
Me	OH	OH	PhCO
benzyl	OH	OH	PhCO
2-phenethyl	OH	OH	PhCO
cyclopropylmethyl	OH	OH	MeSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	MeSO ₂
allyl	OH	OH	MeSO ₂
H	OH	OH	MeSO ₂
Me	OH	OH	MeSO ₂
benzyl	OH	OH	MeSO ₂
2-phenethyl	OH	OH	MeSO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	PhSO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	PhSO ₂
allyl	OH	OH	PhSO ₂
H	OH	OH	PhSO ₂
Me	OH	OH	PhSO ₂
benzyl	OH	OH	PhSO ₂
2-phenethyl	OH	OH	PhSO ₂



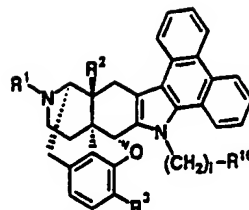
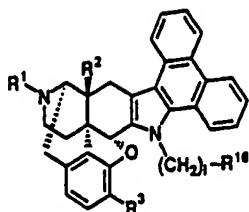
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OH
allyl	OH	OH	2	OH
H	OH	OH	2	OH
Me	OH	OH	2	OH
benzyl	OH	OH	2	OH
2-phenethyl	OH	OH	2	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OMe
allyl	OH	OH	2	OMe
H	OH	OH	2	OMe
Me	OH	OH	2	OMe
benzyl	OH	OH	2	OMe
2-phenethyl	OH	OH	2	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	OEI
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	OEI
allyl	OH	OH	2	OEI
H	OH	OH	2	OEI
Me	OH	OH	2	OEI
benzyl	OH	OH	2	OEI
2-phenethyl	OH	OH	2	OEI
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NH ₂
allyl	OH	OH	2	NH ₂
H	OH	OH	2	NH ₂
Me	OH	OH	2	NH ₂
benzyl	OH	OH	2	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	2	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NO ₂
allyl	OH	OH	2	NO ₂
H	OH	OH	2	NO ₂
Me	OH	OH	2	NO ₂
benzyl	OH	OH	2	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	2	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	CN
allyl	OH	OH	2	CN
H	OH	OH	2	CN
Me	OH	OH	2	CN
benzyl	OH	OH	2	CN
2-phenethyl	OH	OH	2	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NCS
allyl	OH	OH	2	NCS
H	OH	OH	2	NCS
Me	OH	OH	2	NCS
benzyl	OH	OH	2	NCS
2-phenethyl	OH	OH	2	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOH
allyl	OH	OH	2	COOH
H	OH	OH	2	COOH
Me	OH	OH	2	COOH
benzyl	OH	OH	2	COOH
2-phenethyl	OH	OH	2	COOH

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOMe
allyl	OH	OH	2	COOMe
H	OH	OH	2	COOMe
Me	OH	OH	2	COOMe
benzyl	OH	OH	2	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	2	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	COOEI
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	COOEI
allyl	OH	OH	2	COOEI
H	OH	OH	2	COOEI
Me	OH	OH	2	COOEI
benzyl	OH	OH	2	COOEI
2-phenethyl	OH	OH	2	COOEI
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCHO
allyl	OH	OH	2	NHCHO
H	OH	OH	2	NHCHO
Me	OH	OH	2	NHCHO
benzyl	OH	OH	2	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
allyl	OH	OH	2	NHCO-Me
H	OH	OH	2	NHCO-Me
Me	OH	OH	2	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	2	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-Me
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
H	OH	OH	2	NHCO-Ph
Me	OH	OH	2	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)



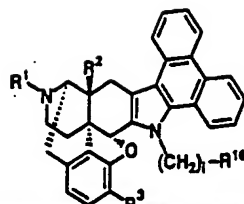
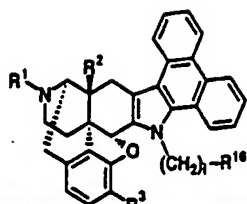
R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
H	OH	OH	2	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	2	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
H	OH	OH	2	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	2	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	2	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OH
allyl	OH	OH	3	OH
H	OH	OH	3	OH
Me	OH	OH	3	OH
benzyl	OH	OH	3	OH
2-phenethyl	OH	OH	3	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OMe
allyl	OH	OH	3	OMe
H	OH	OH	3	OMe
Me	OH	OH	3	OMe
benzyl	OH	OH	3	OMe
2-phenethyl	OH	OH	3	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	OEi
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	OEi
allyl	OH	OH	3	OEi
H	OH	OH	3	OEi
Me	OH	OH	3	OEi
benzyl	OH	OH	3	OEi
2-phenethyl	OH	OH	3	OEi
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NH ₂
allyl	OH	OH	3	NH ₂
H	OH	OH	3	NH ₂
Me	OH	OH	3	NH ₂
benzyl	OH	OH	3	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	3	NH ₂

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NO ₂
allyl	OH	OH	3	NO ₂
H	OH	OH	3	NO ₂
Me	OH	OH	3	NO ₂
benzyl	OH	OH	3	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	3	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	CN
allyl	OH	OH	3	CN
H	OH	OH	3	CN
Me	OH	OH	3	CN
benzyl	OH	OH	3	CN
2-phenethyl	OH	OH	3	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NCS
allyl	OH	OH	3	NCS
H	OH	OH	3	NCS
Me	OH	OH	3	NCS
benzyl	OH	OH	3	NCS
2-phenethyl	OH	OH	3	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOH
allyl	OH	OH	3	COOH
H	OH	OH	3	COOH
Me	OH	OH	3	COOH
benzyl	OH	OH	3	COOH
2-phenethyl	OH	OH	3	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOMe
allyl	OH	OH	3	COOMe
H	OH	OH	3	COOMe
Me	OH	OH	3	COOMe
benzyl	OH	OH	3	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	3	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	COOEt
allyl	OH	OH	3	COOEt
H	OH	OH	3	COOEt
Me	OH	OH	3	COOEt
benzyl	OH	OH	3	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	3	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCHO
allyl	OH	OH	3	NHCHO
H	OH	OH	3	NHCHO
Me	OH	OH	3	NHCHO
benzyl	OH	OH	3	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Me
allyl	OH	OH	3	NHCO-Me
H	OH	OH	3	NHCO-Me
Me	OH	OH	3	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	3	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-Me



R ¹	R ²	R ³	i	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
H	OH	OH	3	NHCO-Ph
Me	OH	OH	3	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
allyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
H	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
Me	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-(CH ₂) ₃ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
H	OH	OH	3	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	3	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
H	OH	OH	3	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	3	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	3	NHCS-NHCH ₂ Ph

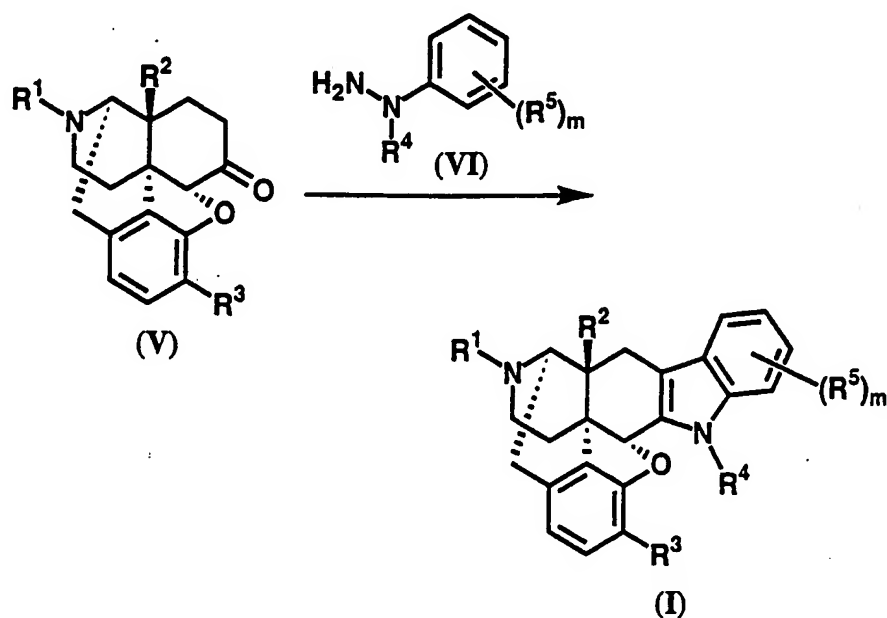
R ¹	R ²	R ³	i	R ¹⁶
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OH
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OH
allyl	OH	OH	4	OH
H	OH	OH	4	OH
Me	OH	OH	4	OH
benzyl	OH	OH	4	OH
2-phenethyl	OH	OH	4	OH
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OMe
allyl	OH	OH	4	OMe
H	OH	OH	4	OMe
Me	OH	OH	4	OMe
benzyl	OH	OH	4	OMe
2-phenethyl	OH	OH	4	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	OEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	OEt
allyl	OH	OH	4	OEt
H	OH	OH	4	OEt
Me	OH	OH	4	OEt
benzyl	OH	OH	4	OEt
2-phenethyl	OH	OH	4	OEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NH ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NH ₂
allyl	OH	OH	4	NH ₂
H	OH	OH	4	NH ₂
Me	OH	OH	4	NH ₂
benzyl	OH	OH	4	NH ₂
2-phenethyl	OH	OH	4	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NO ₂
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NO ₂
allyl	OH	OH	4	NO ₂
H	OH	OH	4	NO ₂
Me	OH	OH	4	NO ₂
benzyl	OH	OH	4	NO ₂
2-phenethyl	OH	OH	4	NO ₂
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	CN
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	CN
allyl	OH	OH	4	CN
H	OH	OH	4	CN
Me	OH	OH	4	CN
benzyl	OH	OH	4	CN
2-phenethyl	OH	OH	4	CN
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NCS
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NCS
allyl	OH	OH	4	NCS
H	OH	OH	4	NCS
Me	OH	OH	4	NCS
benzyl	OH	OH	4	NCS
2-phenethyl	OH	OH	4	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOH
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOH
allyl	OH	OH	4	COOH
H	OH	OH	4	COOH
Me	OH	OH	4	COOH
benzyl	OH	OH	4	COOH
2-phenethyl	OH	OH	4	COOH



R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁰
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOMe
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOMe
allyl	OH	OH	4	COOMe
H	OH	OH	4	COOMe
Me	OH	OH	4	COOMe
benzyl	OH	OH	4	COOMe
2-phenethyl	OH	OH	4	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	COOEt
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	COOEt
allyl	OH	OH	4	COOEt
H	OH	OH	4	COOEt
Me	OH	OH	4	COOEt
benzyl	OH	OH	4	COOEt
2-phenethyl	OH	OH	4	COOEt
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCHO
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCHO
allyl	OH	OH	4	NHCHO
H	OH	OH	4	NHCHO
Me	OH	OH	4	NHCHO
benzyl	OH	OH	4	NHCHO
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
allyl	OH	OH	4	NHCO-Me
H	OH	OH	4	NHCO-Me
Me	OH	OH	4	NHCO-Me
benzyl	OH	OH	4	NHCO-Me
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-Me
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
allyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
H	OH	OH	4	NHCO-Ph
Me	OH	OH	4	NHCO-Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
allyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
H	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
Me	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
allyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
H	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
Me	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
benzyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-cinnamyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
allyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
H	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
Me	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
benzyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)

R ¹	R ²	R ³	I	R ¹⁰
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
allyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
H	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
Me	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
benzyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
allyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
H	OH	OH	4	NHCO-NHPh
Me	OH	OH	4	NHCO-NHPh
benzyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
allyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
H	OH	OH	4	NHCS-NHPh
Me	OH	OH	4	NHCS-NHPh
benzyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclobutylmethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
allyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
H	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
Me	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
benzyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
2-phenethyl	OH	OH	4	NHCS-NHCH ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	OH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	CN
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	3	NHCS-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	OH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	OMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NH ₂
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	CN
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NCS
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	COOH
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	COOMe
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCHO
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CH ₂) ₂ Ph
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-(CF ₃ -cinnamyl)
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-pyridyl
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCO-NHPh
cyclopropylmethyl	OH	OMe	4	NHCS-NHPh

本発明の一般式 (I) で表される化合物は、一般的にはスキーム 1 に示すように、一般式 (V) で表されるケトン体と一般式 (VI) で表されるフェニルヒドラジン誘導体とを用いたインドール合成反応によって製造される。



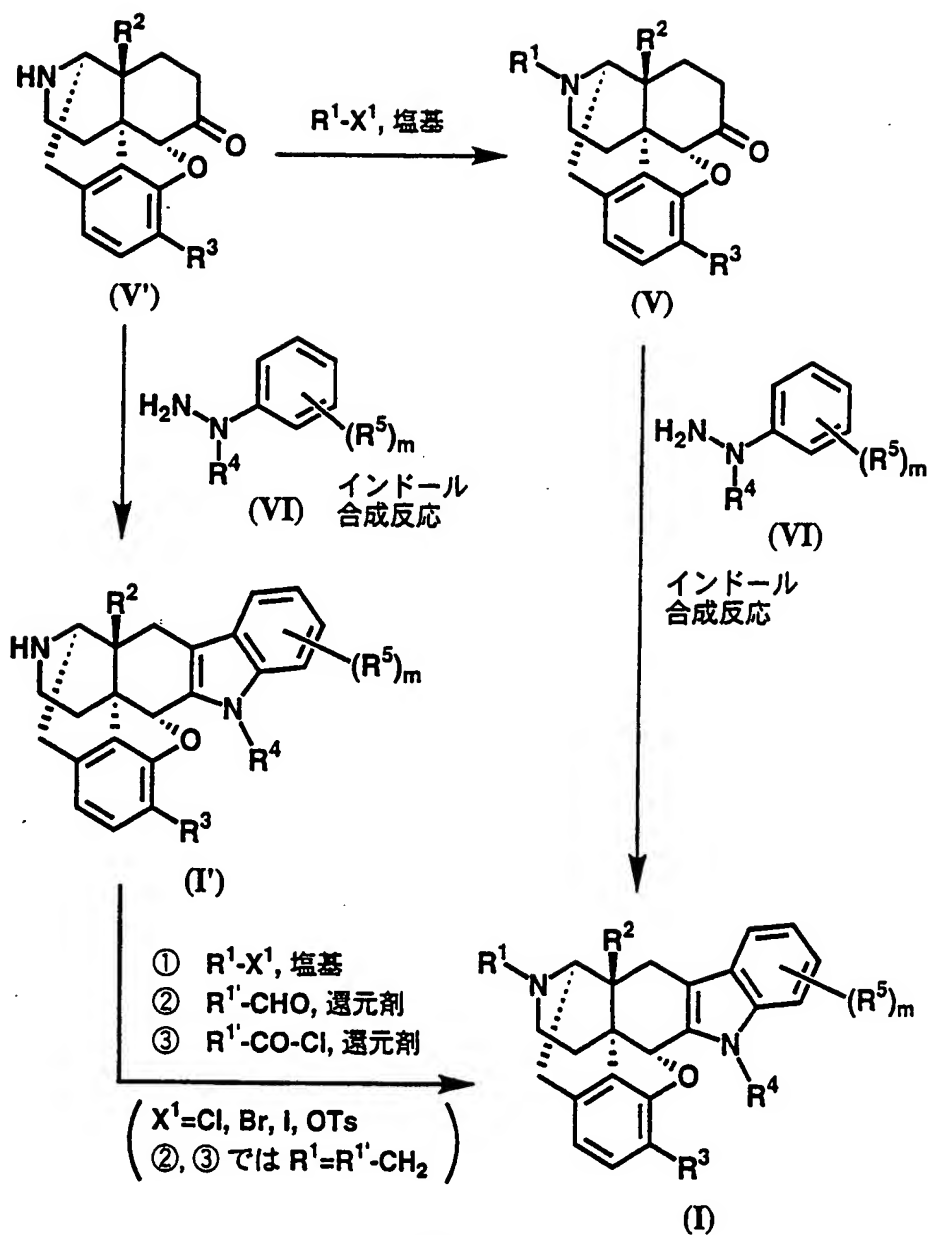
スキーム 1

この方法で製造される本発明の一般式 (I) の化合物のうち一部の化合物は、すでに米国特許 4,816,586 号あるいは国際公開特許 W094/14445 に開示されており、これらに記載の製造方法をそのまま適用することができる。また、これらに記載されていない一般式 (I) の化合物は、以下に説明するようにして同様に製造することができる。

一般式 (V) で表されるケトン体のうち、R²、R³がともにヒドロキシで、R¹が水素、メチル、アリル、シクロプロピルメチルの化合物は、それぞれノルオキシモルホン、オキシモルホン、ナロキソン、ナルトレキソンとして、また R²がヒドロキシ、R³がメトキシで、R¹が水素の化合物は、ノルオキシコドンとして一般に知られており、これらをそのまま用いることができる。また、R¹がこれら以外のケトン体 (V) は、文献 [J. Med. Chem., vol. 35, 4329 (1992).] に記載

の方法などを用いて、 R^1 が水素であるノルオキシモルホン、ノルオキシコドンから調製することができる。具体的には、スキーム2の上-右式に示すように、適当な塩基の存在下、ハロゲン化アルキル R^1-X^1 （ここで X^1 はクロロ、プロモ、ヨード、またはp-トルエンスルホニルオキシを表す）などを用いるアルキル化反応を行うことによって、調製することができる。こうして得られる一般式(V)で表されるケトン体を用いてインドール合成反応を行うことによって一般式(I)の化合物を製造することができる。

あるいは、本発明の化合物(I)は、上記ケトン体(V')を用いてインドール合成反応を行って得られる、 R^1 が水素である一般式(I')で表される本発明の化合物（ここで R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 m は前記定義に同じ）に対して、以下に示す①、②、③のいずれかの方法を実施することによって、本発明の化合物(I)を製造することもできる。すなわち、スキーム2の左-下式に示すように、 R^1 が水素である一般式(V')で表されるケトン体（ここで R^2 、 R^3 は前記定義に同じ）に対して、①適当な塩基の存在下、ハロゲン化アルキル R^1-X^1 （ここで X^1 は上記定義に同じ）などを用いるアルキル化反応、②適当なアルデヒド R^1-CHO （ここで R^1 は、 R^1 より1個の末端メチレンを除いたものを表す）と、水素化シアノホウ素ナトリウム、水素化トリアセトキシホウ素ナトリウムなどの還元剤あるいは水素添加反応を用いる還元的アミノ化反応、あるいは、③常法に従って適当な酸塩化物 $R^1-CO-Cl$ （ここで R^1 は上記定義に同じ）などを用いて一旦アミド化した後、水素化アルミニウムリチウム、ボランなどの還元剤を用いてアミドを還元する方法を行うことによって、本発明の化合物(I)を製造することもできる。

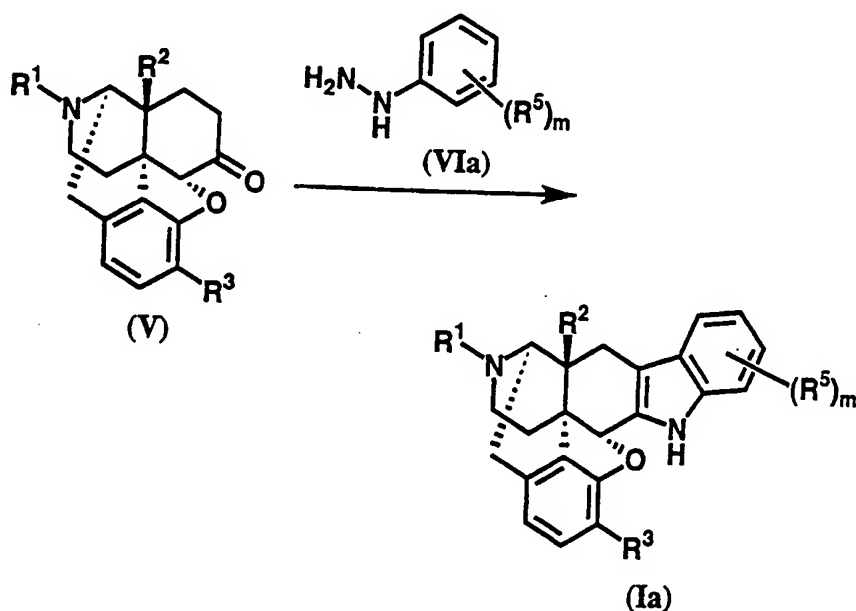


スキーム 2

本発明で行うインドール合成反応は、一般に適当な溶媒中、必要に応じて適当な酸の存在下で反応させることで実施することができる。溶媒としては、メタノール、エタノールなどのアルコール系溶媒、ギ酸、酢酸、プロピオン酸などの有機カルボン酸系溶媒、DMF、DMSOなどの非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエンなどの炭化水素系溶媒などを挙げることができるが、中でもアルコー

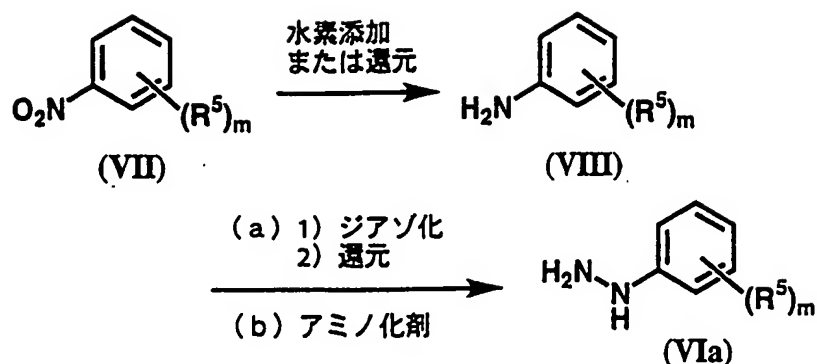
ル系溶媒、有機酸系溶媒が好ましく用いられ、通常はエタノール、酢酸を用いることで十分満足する結果が得られる。酸としては、塩酸、硫酸、硝酸、リン酸などの無機酸、ギ酸、酢酸、プロピオン酸などの有機カルボン酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸、カンファースルホン酸などの有機スルホン酸、塩化亜鉛、三塩化リンなどの Lewis 酸など、広範な酸が挙げられるが、これらの中でも塩酸、硫酸、リン酸、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸、カンファースルホン酸、塩化亜鉛が通常好ましく用いられ、特に塩酸、硫酸、メタンスルホン酸、また溶媒と兼ねて酢酸が好ましい。

本発明で用いる一般式 (I) で表される化合物のうち、 R^4 が水素である一般式 (I a) で表される化合物 (R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 m は前記定義に同じ) は、スキーム 3 に示すように、 R^4 が水素である一般式 (VI a) で表されるフェニルヒドラジン誘導体 (R^5 、 m は前記定義に同じ) を用いて製造される。



スキーム 3

ここで用いるフェニルヒドラジン誘導体 (VI a) は、市販されているものをそのまま使用することができるが、スキーム 4 に示すように、対応するニトロベンゼン誘導体 (VII) (R^5 、 m は前記定義に同じ) もしくはアニリン誘導体 (VIII) (R^5 、 m は前記定義に同じ) から調製することもできる。

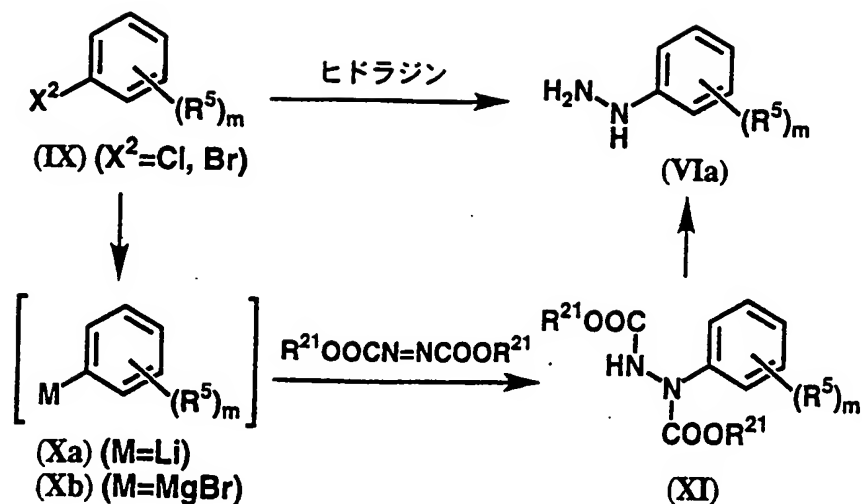


スキーム 4

ここで、ニトロベンゼン誘導体 (VII) は、通常、水素添加反応、または水素化金属還元剤、金属、ハロゲン化金属などを用いる一般的なニトロ基の還元反応によって、アニリン誘導体 (VIII) に導かれる。

アニリン誘導体 (VIII) からフェニルヒドラジン誘導体 (VIa) を調製する方法としては、スキーム 4 下式 (a) に示すように、通常、塩酸、硫酸、酢酸などの酸性条件下、亜硝酸ナトリウムなどの亜硝酸塩と反応させてジアゾ化し、これを同様の酸性条件下、塩化スズ、塩化鉄、スズ、鉄、亜鉛、亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウムなどを用いて還元する方法が一般的に用いられる。また、例えば文献 [Synthesis, 1 (1977).] に記載の *o*-メシチレンスルホニルヒドロキシルアミンなどのアミノ化剤を用いたスキーム 3 下式 (b) に示すような方法によっても調製することができる。

また、フェニルヒドラジン誘導体 (VIa) は、スキーム 5 に示すように、ハロゲン化ベンゼン誘導体 (IX) (ここで X^2 はクロロまたはブロモを表し、 R^5 、 m は前記定義に同じ) から調製することもできる。



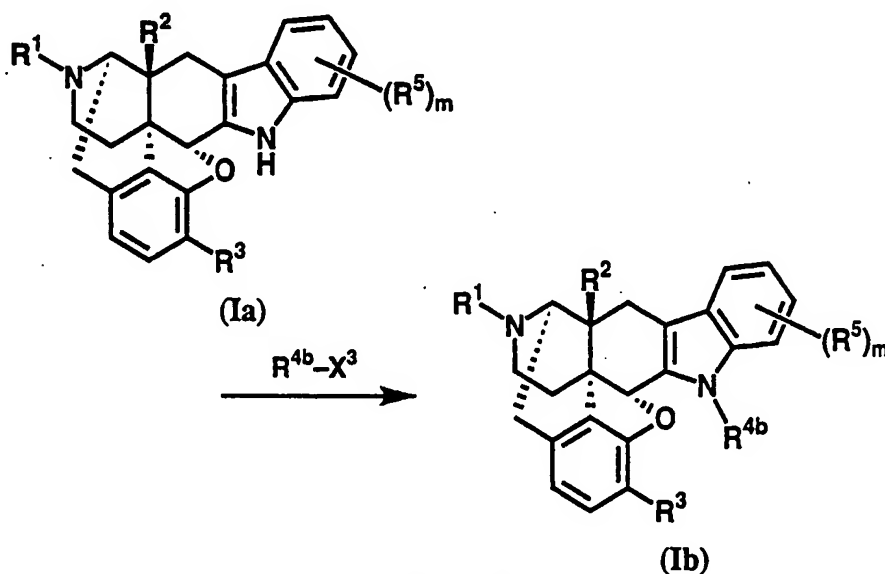
スキーム 5

この方法としては、通常塩化ベンゼン誘導体（IX、 $X^2=Cl$ ）を用い、エタノールなどのアルコールや水、あるいはこれらの混合溶媒などの溶媒中、ヒドラジンもしくはその水和物を用いて直接ヒドラジン化する方法が挙げられる。また別の方法としては、通常臭化ベンゼン誘導体（IX、 $X^2=Br$ ）を用い、常法に従って一旦フェニルリチウム誘導体（Xa）（ここでMはLiを表す）または Grignard 誘導体（Xb）（ここでMはMgBrを表す）に変換し、これとジアルキルアゾジカルボキシラートを反応させてビス（アルコキシカルボニル）フェニルヒドラジン誘導体（XI）（ここで R^{21} は炭素数1～5のアルキルを表す）に導き、これを加水分解してフェニルヒドラジン誘導体（VIa）を得る文献 [Tetrahedron Lett., vol. 28, 4933. (1987).] 記載の方法が挙げられる。ここで、 R^{21} としてはエチルで十分満足される結果が得られる。また、ビス（アルコキシカルボニル）フェニルヒドラジン誘導体（XI）の加水分解は酸性、塩基性いずれの条件でも実施可能であるが、このうち酸性条件下での実施が好ましく、通常塩酸酸性の条件が好ましく用いられる。この方法を実施する場合には、中間体のビス（アルコキシカルボニル）フェニルヒドラジン誘導体（XI）自体を、フェニルヒドラジン誘導体（VIa）と同様に、酸性条件下で実施されるインドール合成反応に直接用いることも可能である。

上記のような幾つかのフェニルヒドラジン誘導体（VIa）の調製法は、原料

の入手可能性、反応性、置換基 R^5 の反応感受性の違いなどに応じて適宜選択されて適用される。

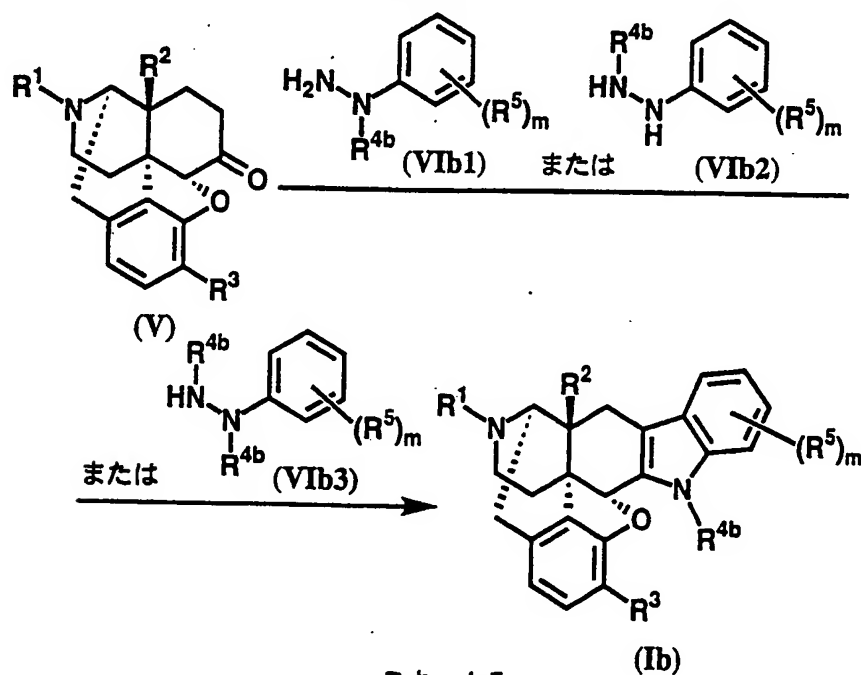
本発明の一般式 (I) で表される化合物のうち、 R^4 が炭素数 1～8 のアルキルまたは炭素数 7～13 のアラルキル（ただし、1 種以上の置換基 R^{15} により置換されていてもよく、 R^{15} はフルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ニトロ、炭素数 1～5 のアルキル、炭素数 1～5 のアルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、またはシアノを表す）からなる置換基 R^{4b} である一般式 (I b) で表される化合物 (R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , m は前記定義に同じ) は、例えばスキーム 6 に示すように、 R^4 が水素である一般式 (I a) で表される化合物に対して、通常塩基性条件下、アルキル化剤 $R^{4b}-X^3$ （ここで X^3 は、クロロ、ブロモ、ヨード、メタンスルホニルオキシ、トリフルオロメタンスルホニルオキシ、ベンゼンスルホニルオキシ、または *p*-トルエンスルホニルオキシを表す）を用いてインドール環窒素をアルキル化し、置換基 R^{4b} を導入することによって製造することができる。



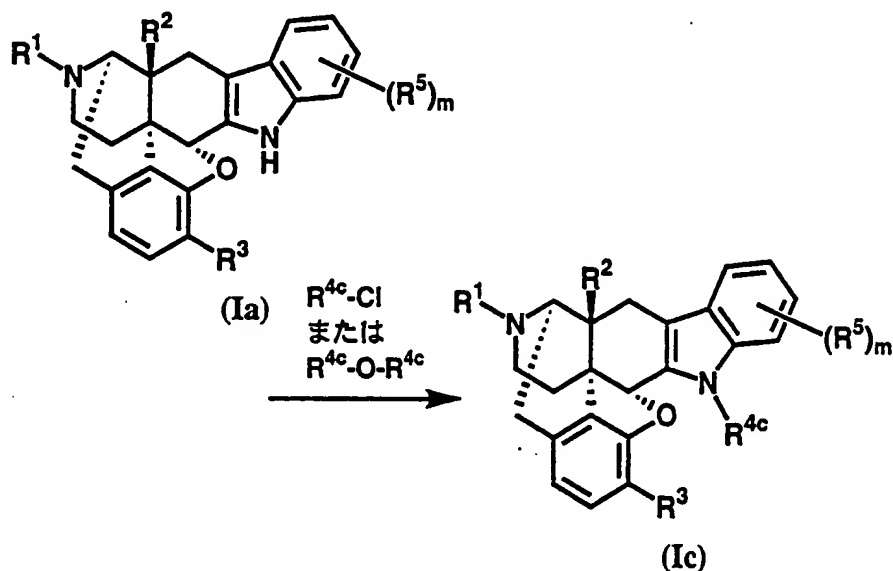
ここで用いるアルキル化剤 $R^{4b}-X^3$ としては、 X^3 がクロロ、ブロモ、ヨード、*p*-トルエンスルホニルオキシのものが通常好ましく用いられる。塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、ナトリウムアルコキシド、カリウムア

ルコキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、ブチルリチウムなどが挙げられる。溶媒としてはベンゼン、トルエンなどの炭化水素系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタンなどのハロゲン系溶媒、ジエチルエーテル、THF、DME、ジオキサンなどのエーテル系溶媒、メタノール、エタノールなどのアルコール系溶媒、DMF、DMSOなどの非プロトン性極性溶媒などが用いられる。これら塩基と溶媒の組み合わせとして具体的には、水酸化ナトリウムまたは水酸化カリウムの水溶液とベンゼン、トルエン、またはジクロロメタンなどを用いた二層系溶媒中で、硫酸水素テトラブチルアンモニウム、臭化テトラブチルアンモニウムなどの層間移動触媒、あるいは必要に応じてクラウンエーテルを用いる条件、DMFまたはDMSO溶媒中、粉末状の水酸化ナトリウムまたは水酸化カリウムを用いる条件、THF、DMF、DMSOなどの溶媒中、水素化ナトリウムを用いる条件が好ましく用いられる。

また、一般式 (I b) で表される化合物は、スキーム 7 に示すように、一般式 (V) で表されるケトン体と、 R^{4b} によって置換された一般式 (VI b 1)、(VI b 2)、または (VI b 3) で表されるフェニルヒドラジン誘導体を用いたインドール合成反応によっても製造することができる。



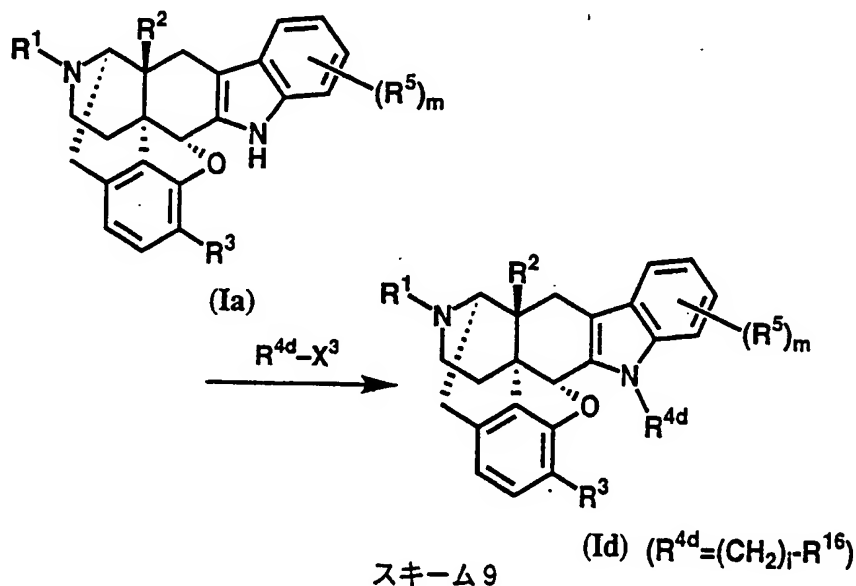
本発明の一般式 (I) で表される化合物のうち、 R^4 が炭素数 1～5 のアルカノイル、炭素数 7～13 のアリアルカルボニル (ただし、1 種以上の置換基 $R^{15'}$ により置換されていてもよく、 $R^{15'}$ は前記定義に同じ)、炭素数 1～5 のアルキルスルホニル、炭素数 6～12 のアリアルスルホニル (ただし、1 種以上の置換基 $R^{16'}$ により置換されていてもよく、 $R^{16'}$ は前記定義に同じ)、炭素数 7～13 のアラルキルスルホニル (ただし、1 種以上の置換基 $R^{16'}$ により置換されていてもよく、 $R^{15'}$ は前記定義に同じ) からなる置換基 R^{4c} である一般式 (Ic) で表される化合物 (R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 m は前記定義に同じ) は、例えばスキーム 8 に示すように、 R^4 が水素である一般式 (Ia) で表される本発明で用いる化合物に対して、塩基性条件下、酸塩化物またはスルホン酸塩化物 $R^{4c}-Cl$ 、あるいは酸無水物またはスルホン酸無水物 $R^{4c}-O-R^{4c}$ を用いてインドール環窒素をアシル化またはスルホニル化し、置換基 R^{4c} を導入することによって製造することができる。



これらアシル化およびスルホニル化反応は、通常酸塩化物またはスルホン酸塩化物 $R^{4c}-Cl$ を使い、前記スキーム 6 で示した置換基 R^b を導入するアルキル化反応と同様の条件によって実施することができる。このうち特に水酸化ナトリウムまたは水酸化カリウムの水溶液とベンゼン、トルエン、またはジクロロメタ

ンなどを用いた二層系溶媒中で、硫酸水素テトラブチルアンモニウム、臭化テトラブチルアンモニウムなどの層間移動触媒を用いる条件、DMFまたはDMSO溶媒中、粉末状の水酸化ナトリウムまたは水酸化カリウムを用いる条件、THF、DMF、DMSOなどの溶媒中、水素化ナトリウムを用いる条件が好ましく用いられる。

本発明の一般式(I)で表される化合物のうち、 R^4 が $(CH_2)_i-R^{16}$ (i は前記定義に同じ)であり、この R^{16} が OR^7 、 NR^7R^7 、シアノからなる置換基 R^{4d} (R^7 、 R^7 は前記定義に同じ)である一般式(Id)で表される化合物(R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 m は前記定義に同じ)は、例えばスキーム9に示すように、 R^4 が水素である一般式(Ia)で表される本発明で用いる化合物に対して、塩基性条件下、アルキル化剤 $R^{4d}-X^3$ (X^3 は前記定義に同じ)を用いてインドール環窒素に置換基 R^{4d} を導入することによって製造することができる。

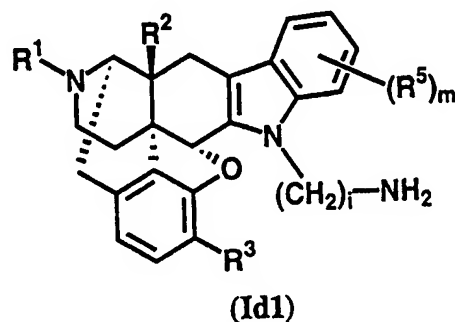


この置換基の導入は、通常 X^3 がクロロ、ブロモ、ヨード、p-トルエンスルホンオキシであるアルキル化剤 $R^{4d}-X^3$ を用い、前記スキーム6で示した置換基 R^{4b} を導入するアルキル化反応と同様の条件によって実施することができる。このうち特に水酸化ナトリウムまたは水酸化カリウムの水溶液とベンゼン、トルエン、またはジクロロメタンなどを用いた二層系溶媒中で、硫酸水素テトラブチル

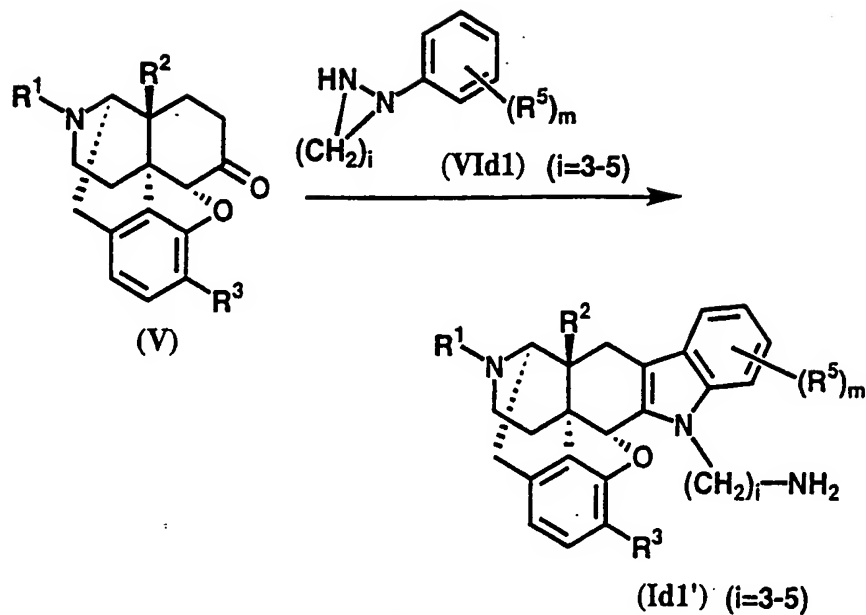
アンモニウム、臭化テトラブチルアンモニウムなどの層間移動触媒を用いる条件、DMFまたはDMSO溶媒中、粉末状の水酸化ナトリウムまたは水酸化カリウムを用いる条件が好ましく用いられる。

また、一般式(I d)で表される化合物のうち、 R^{16} が OR^7 であり、特に R^7 が水素である化合物は、 R^7 がメチルである化合物のメチル基を、通常ジクロロメタン、クロロホルム、または1, 2-ジクロロエタンを溶媒として用い、三臭化ホウ素〔文献：Tetrahedron, vol. 24, 2289 (1968).〕や三塩化ホウ素を用いる方法、通常DMF中でチオアルコキシド、中でもナトリウムチオエトキシド〔文献：Tetrahedron Lett., 1327 (1970).〕を用いる方法などを用いて脱メチル化することによって製造することもできる。

一般式(I d)で表される化合物のうち、 R^{16} が $(CH_2)_i-R^{16}$ (i は前記定義に同じ)であり、この R^{16} が NR^7R^7 であり、特に R^7 、 R^7 がともに水素である化合物を、下図一般式(I d 1) (R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 m は前記定義に同じ)で定義する。

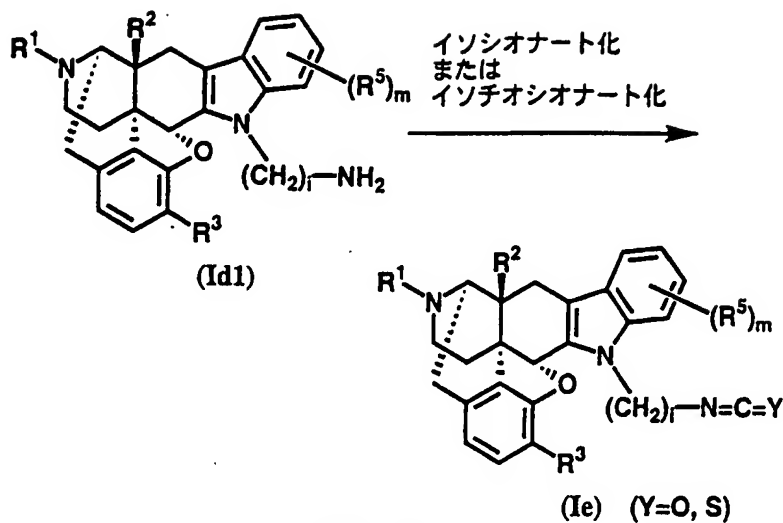


このうち特に i が3~5の整数である一般式(I d 1')で表される化合物は、上記製造方法に加えて、例えばスキーム10に示すように、一般式(V)のケトン体に対して、文献[J. Pharm. Sci., vol. 68, 377 (1979). Tetrahedron, vol. 29, 4045 (1973).]に記載の方法で調製できる一般式(V I d 1)で表される環状ヒドラジン化合物 (i は3~5の整数を表し、 R^5 、 m は前記定義に同じ)を用いてインドール合成反応を行うことによっても製造することができる。



スキーム 10

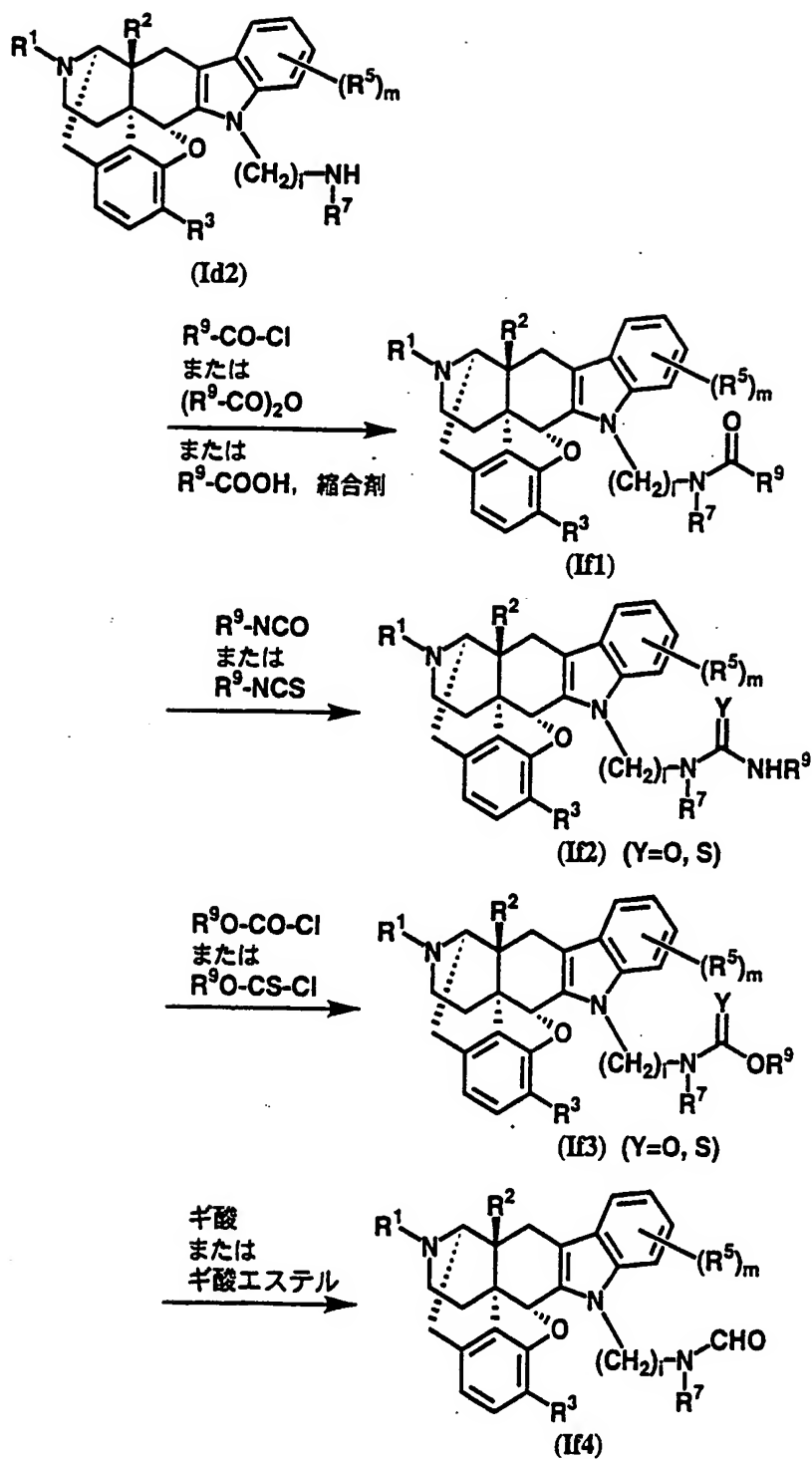
本発明の一般式 (I) で表される化合物のうち、 R^4 が $(CH_2)_i-R^{16}$ (i は前記定義に同じ) であり、この R^{16} がイソシアナト、イソチオシアナトからなる置換基 R^{16} である一般式 (I e) で表される化合物 (Y はOまたはSを表し、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 m は前記定義に同じ) は、例えばスキーム 11 に示すように、一般式 (I d 1) で表される化合物を用いてイソシアナート化またはイソチオシアナート化することによって製造することができる。



スキーム 11

このイソシアナート化は、ベンゼン、トルエン、ピリジン、エタノール、ジクロロメタン、クロロホルムなどの溶媒中、常法に従ってホスゲンやトリホスゲンを用いることで実施することができる。また、イソチオシアナート化は、通常ベンゼン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、アセトン溶媒中、あるいは水酸化ナトリウム、炭酸水素ナトリウムなどの塩基性水溶液とジクロロメタン、クロロホルムなどとの二層系溶媒中、チオホスゲンを用いる方法や、ジクロロメタン中、ジー（２－ピリジル）チオノカルボナートを用いる方法 [Tetrahedron Lett., vol. 26, 1661 (1985).] によって実施することができる。

本発明の一般式 (I) で表される化合物のうち、 R^4 が $(CH_2)_i-R^{16}$ (i は前記定義に同じ) であり、この R^{16} がそれぞれ $NR^7(C=O)-R^9$ 、 $NR^7(C=Y)NHR^9$ 、 $NR^7(C=Y)O-R^9$ 、 NR^7CHO 、(R^7 、 R^9 、 Y は前記定義に同じ) である一般式 (If1)、(If2)、(If3)、(If4) で表される化合物 (R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 m は前記定義に同じ) は、例えばスキーム 12 に示すように、一般式 (Id2) で表される化合物に、カルボン酸塩化物 $R^9-CO-Cl$ 、カルボン酸無水物 $(R^9-CO)_2O$ 、カルボン酸 R^9-COOH 、イソシアナート R^9-NCO 、イソチオシアナート R^9-NCS 、クロロギ酸エステル $R^9O-CO-Cl$ 、クロロチオノギ酸エステル $R^9O-CS-Cl$ 、ギ酸、ギ酸エステルなどを縮合させて製造することができる。



スキーム 12

カルボン酸塩化物 $R^9-CO-Cl$ 、カルボン酸無水物 $(R^9-CO)_2O$ 、クロロギ酸エステル $R^9O-CO-Cl$ 、クロロチオノギ酸エステル $R^9O-CS-Cl$ との縮合は、通常塩基としてトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、プロトンスポンジ等の3級アミンや、ピリジン、ジメチルアミノピリジン、イミダゾール等の有機塩基、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどの無機塩基等を用い、溶媒としてジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン系溶媒、エーテル、THF、DME、ジオキサン等のエーテル系溶媒、ピリジン、水またはそれらの混合溶媒等を用いることで実施することができる。中でもカルボン酸塩化物、クロロギ酸エステル、およびクロロチオノギ酸エステルの場合には、ジクロロメタンまたはクロロホルム中、トリエチルアミンを用いる条件、THF-水混合溶媒中、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、または炭酸水素ナトリウムを用いる条件が、カルボン酸無水物を用いる場合は、ピリジンを塩基兼溶媒として用いる条件が、それぞれ好ましく用いられる。

カルボン酸 R^9-COOH との縮合は、一般に知られているあらゆる縮合剤を用いて通常実施することができるが、とりわけN, N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド（以下DCCと略す）、1, 1'-カルボニルジイミダゾール（以下CDIと略す）、ビス-(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)ホスフィン酸塩化物（以下BOPCIと略す）などの縮合剤が好ましく用いられる。DCCを用いる場合は、反応溶媒としてジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン系溶媒、エーテル、THF、DME、ジオキサン等のエーテル系溶媒中、塩基としてトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、プロトンスポンジ等の3級アミンや、ピリジン、ジメチルアミノピリジン、イミダゾール等の有機塩基を用いる条件で実施できるが、このうち特にジクロロメタン、クロロホルム中、ジメチルアミノピリジンが好ましく用いられる。CDIを用いる場合は、溶媒としてエーテル、THF、DME、ジオキサン等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン系溶媒が用いられ、特にTHFが好ましく用いられる。BOPCIを用いる場合は、溶媒としてジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素

、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン系の溶媒、エーテル、THF、DME、ジオキサン等のエーテル系溶媒が用いられ、塩基としてトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、プロトンスポンジ、N-エチルピペリジン等の3級アミンや、ピリジン、ジメチルアミノピリジン、イミダゾール等の有機塩基が用いられるが、これらの中でも、ジクロロメタンまたはクロロホルム中、特にN-エチルピペリジンが好ましく用いられる。

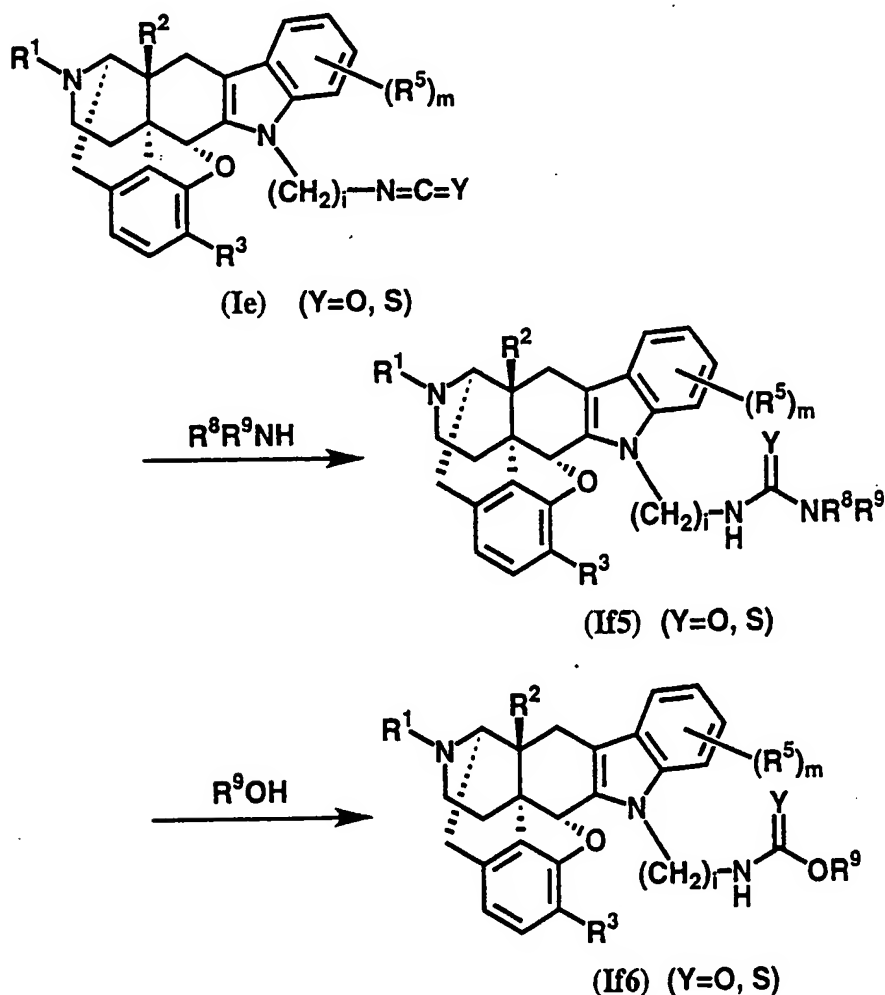
イソシアナート R^9-NCO 、イソチオシアナート R^9-NCS との縮合は、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン系溶媒、エーテル、THF、DME、ジオキサン等のエーテル系溶媒中で直接実施することができるが、中でもクロロホルムが好ましく用いられる。

また、一般式(I f 4)で表される化合物は、通常ギ酸あるいはギ酸エステル(メチルあるいはエチルエステル)を用いて直接ホルミル化することで製造することができるが、ギ酸と無水酢酸を用いる方法、ギ酸エステルとトリエチルアミンなどの塩基を用いる方法、ギ酸と酢酸などの酸無水物を用いる方法、DMFとオキシ塩化リンまたはナトリウムメトキシドを用いる方法など、一般に知られているあらゆるホルミル化の方法を適用することができる。

このスキーム12に示した工程において、一般式(I d 2)で表される化合物のうち、 R^3 が特にヒドロキシである場合には、このフェノール性水酸基も同時に反応した縮合生成物が得られることがあるが、この場合は、この縮合反応に引き続いて、塩基性条件で加水分解処理を行なうことで、目的の R^3 がヒドロキシである一般式(I f 1)、(I f 2)、(I f 3)、(I f 4)で表される化合物を得ることができる。この加水分解反応は、塩基として炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどの無機塩基、とりわけ炭酸カリウム、水酸化ナトリウムを用い、水、メタノール、エタノール等のアルコール系溶媒、エーテル、THF、DME、ジオキサン等のエーテル系溶媒、またはそれらの混合溶媒、また溶解度が十分でないときはジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン系溶媒を適宜加えた溶媒中で実施することができる。

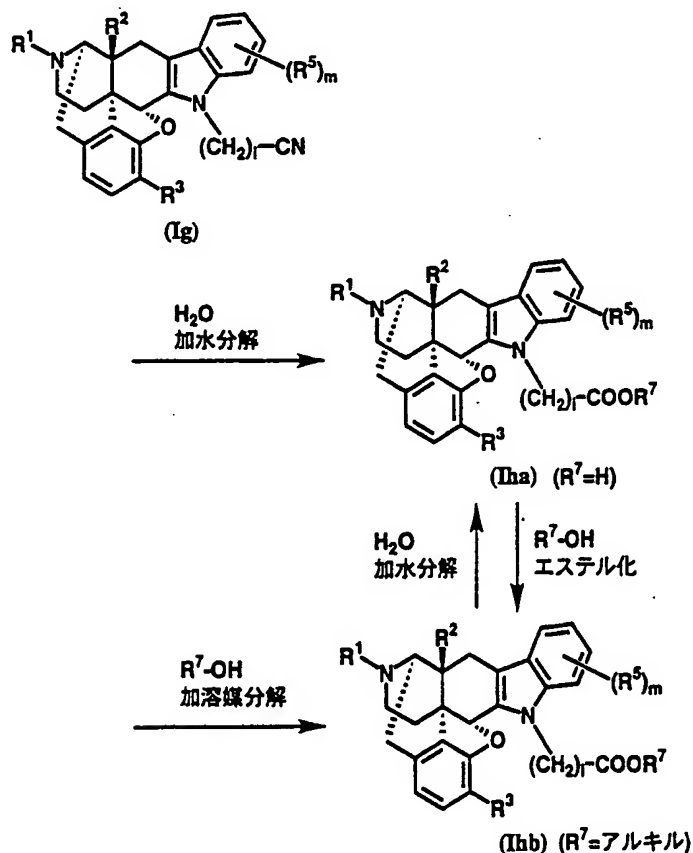
また本発明の一般式(I)で表される化合物のうち、 R^4 が $(CH_2)_1-R^{16}$ (

i は前記定義に同じ) であり、この R^{16} がそれぞれ $NH(C=Y)NR^8R^9$ 、 $NH(C=Y)O-R^9$ (R^8 、 R^9 、 Y は前記定義に同じ) である一般式 (If5)、(If6) で表される化合物 (R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 m は前記定義に同じ) は、例えばスキーム 13 に示すように、一般式 (Ie) で表されるイソシアナートあるいはイソチオシアナート (R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 m 、 i 、 Y は前記定義に同じ) に、アミン R^8R^9NH あるいはアルコール R^9OH を縮合させることによって製造することができる。この縮合反応は、通常ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン系溶媒、エーテル、THF、DME、ジオキサン等のエーテル系溶媒中で直接実施することができる。



スキーム 13

本発明の一般式 (I) で表される化合物のうち、 R^4 が $(CH_2)_i-R^{16}$ (i は前記定義に同じ) であり、この R^{16} が $COOR^7$ (R^7 は前記定義に同じ) である一般式 (Iha) (R^7 は水素) または (Ihb) (R^7 は炭素素数 1~5 のアルキル) で表される化合物 (R^1, R^2, R^3, R^5, m は前記定義に同じ) は、例えばスキーム 14 に示すように、一般式 (Id) で表される化合物のうち R^4 が $(CH_2)_i-R^{16}$ (i は前記定義に同じ) であり、この R^{16} がシアノである一般式 (Ig) で表される本発明で用いる化合物に対して、水またはアルコール R^7OH を用いて加溶媒分解することによって製造することができる。また、ここで得られる R^7 が水素である一般式 (Iha) のカルボン酸をエステル化することによって R^7 がである一般式 (Ihb) のエステルを、逆に R^7 がである一般式 (Ihb) のエステルを加水分解することによって一般式 (Iha) のカルボン酸を製造することができる。

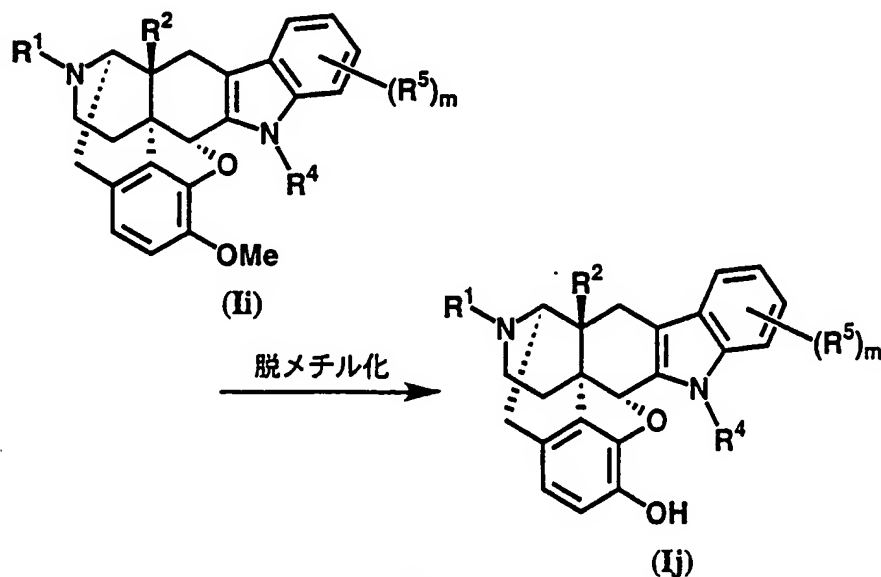


スキーム 14

加溶媒分解は、一般に知られるあらゆる方法を用いることができるが、特に一般式 (I h a) への加水分解は、通常塩酸、硫酸、リン酸、酢酸などの酸を用いた酸性条件下、または水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどの塩基を用いた塩基性条件下、水溶液あるいは含水アルコール中で十分実施することができる。また、一般式 (I h b) への加溶媒分解は、通常アルコール中、塩酸、硫酸、p-トルエンスルホン酸などの酸を用いることで実施することができる。

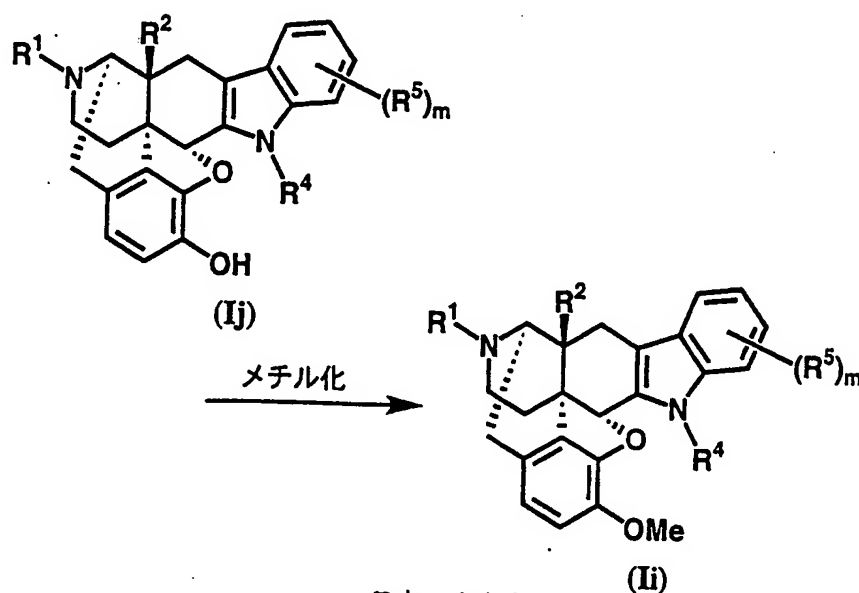
エステル化は、アルコール R^7OH を用いて、適当な酸または塩基と必要に応じて適当な縮合剤を用いる方法、一旦酸塩化物や酸無水物などに変換してからアルコール R^7OH と縮合させる方法など、一般的に用いられるあらゆる方法を適用することができる。また、エステルの加水分解は、上記加水分解と同様な通常行われる適当な酸あるいは塩基を用いる方法によって十分実施することができる。

本発明の一般式 (I) で表される化合物のうち、 R^3 がメトキシである一般式 (I i) で表される化合物 (R^1, R^2, R^4, R^5, m は前記定義に同じ) は、スキーム 15 に示すように、フェノール性メチルエーテルの一般的な脱メチル化反応によって、 R^3 がヒドロキシである一般式 (I j) で表される化合物 (R^1, R^2, R^4, R^5, m は前記定義に同じ) に変換することができる。



この脱メチル化反応は、一般的に知られているあらゆる条件を適用することができるが、とりわけ通常ジクロロメタン、クロロホルム、または1, 2-ジクロロエタンを溶媒として用い、三臭化ホウ素〔文献：Tetrahedron, vol. 24, 2289 (1968).〕や三塩化ホウ素を用いる方法、通常DMF中でチオアルコキシド、中でもナトリウムチオエトキシド〔文献：Tetrahedron Lett., 1327 (1970).〕を用いる方法などによって実施することができる。

逆に、本発明の一般式(I)で表される化合物のうち、 R^3 がメトキシである一般式(Ii)で表される化合物(R^1 , R^2 , R^4 , R^5 , m は前記定義に同じ)は、スキーム16に示すように、 R^3 がヒドロキシである一般式(Ij)で表される化合物(R^1 , R^2 , R^4 , R^5 , m は前記定義に同じ)のフェノール性水酸基を一般的な方法でメチル化することによって製造することもできる。



スキーム16

このメチル化反応は、一般的に知られているあらゆる条件を適用することができるが、なかでもDMF、アセトンなどの溶媒中、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸リチウムなどの無機塩基の共存下、ヨウ化メチルを用いる方法、ジエチルエーテルなどの溶媒中、シリカゲルの存在下、ジアゾメタンを用いる方法などが好ましく用いられる。

一般式 (I) で表される本発明のインドロモルヒナン誘導体は、以下の実施例に示すように、*in vitro*、*in vivo* における薬理評価の結果、脳神経細胞障害に対して優れた効果を示したことから、本発明の化合物は、脳障害治療・予防剤、すなわち各種脳疾患およびその後遺症の改善、再発予防に有用な医薬品として用いられる。より具体的には、本発明の化合物は、脳卒中治療剤、外傷性脳疾患治療剤、脳浮腫治療剤、虚血障害疾患治療剤、脳神経変性疾患治療剤、脳疾患後遺症治療剤として利用できることが明らかになった。また、本発明の化合物は、脳神経細胞への障害に対する優れた保護作用を示したことから、虚血性または出血性脳血管障害や外傷性脳障害、各種脳神経変性障害において、脳神経細胞に対する保護作用によりその障害を抑制する脳神経細胞保護剤として有用であることが判明した。

ここでいう脳卒中治療剤とは、虚血性または出血性の脳卒中、具体的には脳梗塞（脳塞栓、脳血栓）、脳出血、クモ膜下出血、一過性脳虚血発作（TIA）、高血圧性脳症などの治療あるいは改善、またはこれらを予防するために用いる薬剤である。また、外傷性脳疾患治療剤とは、外傷に起因する脳障害やそれに伴う脳機能障害の改善、後遺症の軽減などのために使用される薬剤である。また、脳浮腫治療剤とは、脳内に発生した出血、梗塞、腫瘍、外傷などの病変や頭蓋内圧上昇などにより生成する脳浮腫を改善あるいは治療、または予防し、脳浮腫による脳神経細胞障害を軽減するために用いる薬剤である。また、虚血障害疾患治療剤とは、低酸素症、低血糖症、薬物中毒など、虚血に基づく脳神経細胞への酸素、糖の供給不足が原因となって起こる脳障害を治療・改善または予防するために用いる薬剤である。また、脳神経変性疾患治療剤とは、Alzheimer 病、Parkinson 病、Huntington 舞踏病、びまん性 Lewy 小体病、Creutzfeldt-Jakob 病などの神経細胞の変性を伴って神経細胞障害が起こる脳疾患を治療あるいは改善、または予防するために用いる薬剤である。さらに、脳疾患後遺症治療剤とは、脳血管性痴呆症、健忘症、意識障害、運動麻痺、言語障害、感覚障害、精神障害、記憶障害など、上記脳障害が原因で現れる後遺症を治療あるいは改善、または予防するために用いる薬剤である。

本発明の脳障害治療・予防剤を医薬品として臨床で使用する際には、薬剤はフ

リーの塩基またはその塩自体でもよく、また賦形剤、安定剤、保存剤、緩衝剤、溶解補助剤、乳化剤、希釈剤、等張化剤などの添加剤が適宜混合されていてもよい。投与形態としては非経口投与、経口投与のいずれでも十分効果が得られる。投与剤型としては注射剤、錠剤、液剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤などが挙げられ、これら剤型は公知の製剤技術によって製造することができる。投与量は患者の症状や年齢、体重、投与方法等に応じて適宜選択されるが、成人に対する有効成分量は1日0.0001mg～10g、好ましくは0.001mg～1gであり、それぞれ1回または数回に分けて投与することができる。

【実施例】

以下、参考例および実施例を挙げて本発明を具体的に説明するが、これらは本発明を限定するものではない。

【参考例1】

17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-インドロモルヒナン1・メタンスルホン酸塩

米国特許 4,816,586 号あるいは国際公開特許 W094/14445 に記載されている方法に準じて合成した。17-シクロプロピルメチル-6-オキソ-4, 5α-エポキシ-3, 14β-ジヒドロキシモルヒナン（ナルトレキソン）・塩酸塩 150 g (40 mmol)、フェニルヒドラジン 45.1 g (42 mmol) をエタノール 2.5L に加え、メタンスルホン酸 381 g (4 mol) を加えて、1.5 時間加熱還流した。反応溶液を室温に冷却し、析出した結晶を濾取した。得られた粗結晶 140 g をメタノールより再結晶すると、表題化合物 140 g (収率68%) が得られた。

【参考例2-14】

参考例1に記載の方法に準じ、ナルトレキソンを原料としてインドール合成反応を行って製造した。すなわち、フェニルヒドラジンの代わりに、1, 1-ジフェニルヒドラジンを用いることで、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-(1'-フェニルインドロ)モルヒナン4が、3-シクロヘキシルフェニルヒドラジン(3-シクロヘキシルアニリンより調製)を用いることで、17-シクロ

プロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-(6'-シクロヘキシルインドロ)モルヒナン5が、3-ヘプチルフェニルヒドラジン(3-ヘプチルアニリンより調製)を用いることで、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-(4'-ヘプチルインドロ)モルヒナン6および17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-(6'-ヘプチルインドロ)モルヒナン7が、1-ナフチルヒドラジン(1-プロモナフタレンより調製)を用いることで、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-(6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン2および17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-(4', 5'-ベンゾインドロ)モルヒナン8が、4-プロモ-1-ナフチルヒドラジン(4-プロモ-1-アミノナフタレンより調製)を用いることで、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-(5'-プロモ-6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン9が、4-クロロ-1-ナフチルヒドラジン(4-クロロ-1-アミノナフタレンより調製)を用いることで、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-(5'-クロロ-6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン10が、4-シアノ-1-ナフチルヒドラジン(4-シアノ-1-アミノナフタレンより調製)を用いることで、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-(5'-シアノ-6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン11が、8-クロロ-1-ナフチルヒドラジン(8-クロロ-1-アミノナフタレンより調製)を用いることで、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-(3"-クロロ-6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン12が、4-メチル-1-ナフチルヒドラジン(4-プロモ-1-メチルナフタレンより調製)を用いることで

、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-(5'-メチル-6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン13が、4-フルオロ-1-ナフチルヒドラジン(4-プロモ-1-フルオロナフタレンより調製)を用いることで、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-(5'-フルオロ-6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン14が、4-フェニル-1-ナフチルヒドラジン(4-プロモ-1-フェニルナフタレンより調製)を用いることで、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-(5'-フェニル-6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン15が、それぞれ得られた。

[参考例15-16]

参考例1に記載の方法に準じ、原料としてナルトレキソンの代わりに17-シクロプロピルメチル-6-オキソ-4, 5α-エポキシ-3-メトキシ-14β-ヒドロキシモルヒナン(ナルトレキソン-3-メチルエーテル)を用い、ヒドラジン誘導体として4-t-ブチルフェニルヒドラジン(4-t-ブチルアニリンより調製)、1-ナフチルヒドラジンをを用いてインドール合成反応を行うことで、それぞれ17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-(5'-t-ブチルインドロ)モルヒナン16、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-(6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン17が得られた。

[参考例17]

参考例1に記載の方法に準じ、原料としてナルトレキソンの代わりに、17-シクロプロピルメチル-6-オキソ-4, 5α-エポキシ-14β-ヒドロキシモルヒナンを用い、ヒドラジン誘導体として1-ナフチルヒドラジンをを用いてインドール合成反応を行うことで、17-シクロプロピルメチル-14β-ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-(6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン18が得られた。

[実施例 1-9]

参考例 1 に記載の方法に準じ、ナルトレキソンを原料としてインドール合成反応を行って製造した。すなわち、フェニルヒドラジンの代わりに、5-ヒドラジノアセナフテン（5-ニトロアセナフテンより調製）、3-ヒドラジノフルオランテン（3-アミノフルオランテンより調製）、1-ヒドラジノフルオレン（1-アミノフルオレンより調製）、1-ヒドラジノアントラセン（1-アミノアントラセンより調製）、4-ヒドラジノフルオレン（4-アセトアミノ-9-フルオレノンより調製）、9-ヒドラジノフェナントレン（9-プロモフェナントレンより調製）、1-フェニルピラゾリジン（J. Pharmaceut. Sci., vol. 68, 377 (1979). に記載の方法により調製）、1-(1-ナフチル)ピラゾリジン（同上の文献に記載の方法により調製）、1-(2-シアノエチル)-1-フェニルヒドラジン（Chem. Abst., 81084w (1969). に記載の方法により調製）を用いることで、17-シクロプロピルメチル-3, 14 β -ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(5', 6"-エタノ-6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン3、17-シクロプロピルメチル-3, 14 β -ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(5', 6"-ベンゼノ-6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン19、17-シクロプロピルメチル-3, 14 β -ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(6', 7', 3'', 2"-インデノインドロ)モルヒナン20、17-シクロプロピルメチル-3, 14 β -ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(6', 7', 2'', 3"-ナフトインドロ)モルヒナン21、17-シクロプロピルメチル-3, 14 β -ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(6', 7', 2'', 3"-インデノインドロ)モルヒナン22、17-シクロプロピルメチル-3, 14 β -ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(4', 5', 6', 7'-ジベンゾインドロ)モルヒナン23、17-シクロプロピルメチル-3, 14 β -ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-(3-アミノプロピル)インドロ]モルヒナン24、17-シ

クロプロピルメチル-3, 14 β -ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (3-アミノプロピル) -6', 7' -ベンゾインドロ] モルヒナン 25、17-シクロプロピルメチル-3, 14 β -ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (2-シアノエチル) インドロ] モルヒナン 26が、それぞれ得られた。

[実施例10]

参考例1に記載の方法に準じ、原料としてナルトレキソンの代わりに、17-シクロプロピルメチル-6-オキソ-4, 5 α -エポキシ-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシモルヒナンを用い、ヒドラジン誘導体として3-ヒドラジノフルオランテンを用いてインドール合成反応を行うことで、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3' - (5', 6''-ベンゼノ-6', 7'-ベンゾインドロ) モルヒナン 27が得られた。

[参考例18]

参考例1に記載の方法に準じ、原料としてナルトレキソンの代わりに、6-オキソ-4, 5 α -エポキシ-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシモルヒナン(ノルオキシコドン)を用い、ヒドラジン誘導体として1-ナフチルヒドラジンを用いてインドール合成反応を行うことで、3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3' - (6', 7'-ベンゾインドロ) モルヒナン 28が得られた。

[参考例19]

17-メチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3' - (6', 7'-ベンゾインドロ) モルヒナン 29・メタンスルホン酸塩

3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3' - (6', 7'-ベンゾインドロ) モルヒナン 28 951 mg (2.24 mmol) をDMF 12 ml に溶解し、この溶液に炭酸カリウム 464 mg (3.36 mmol) とヨウ化メチル 0.15 ml (2.41 mmol) を加えて、室温にて2時間攪拌

した。反応終了後、減圧濃縮して得られた残渣に水を加え、クロロホルムにて抽出した。有機層を合わせて無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（アンモニア飽和クロロホルム→メタノール（50:1））で精製すると、表題化合物の塩フリー体 904 mg（収率92%）が得られた。これをメタノールに溶解して、メタンスルホン酸を加えて塩として単離した。

【参考例 20】

17-（2-フェニルエチル）-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5α-エポキシ-6,7,2',3'-(6',7'-ベンゾインドロ)モルヒナン3.0

3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5α-エポキシ-6,7,2',3'-(6',7'-ベンゾインドロ)モルヒナン2.8 1.33 g (3.13 mmol) をジクロロメタン 20 ml に溶解し、トリエチルアミン 1.3 ml (9.33 mmol) を加え、0℃に冷却した。この溶液に塩化フェニルアセチル 0.62 ml (4.69 mmol) を加えて、0℃にて5時間攪拌した後、さらにトリエチルアミン 0.43 ml (3.06 mmol) と塩化フェニルアセチル 0.2 ml (1.51 mmol) を追加し、0℃にて3時間攪拌した。反応溶液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 70 ml を加え、クロロホルム（70 ml x 3）で抽出し、有機層を合わせて無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（アンモニア飽和クロロホルム→アンモニア飽和クロロホルム→メタノール（10:1 →50:1））で2回精製すると、中間アミド体の17-フェニルアセチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5α-エポキシ-6,7,2',3'-(6',7'-ベンゾインドロ)モルヒナン 851 mg（収率50%）が得られた。

次に、このアミド体 842 mg (1.56 mmol) を無水THF 30 ml に溶解し、0℃でボラン・ジメチルスルフィド錯体のTHF溶液 1.04 ml (10.5 mmol) を加えた後、4時間加熱還流した。反応溶液を0℃に冷却して6N塩酸 10 ml を加え、室温にて1時間攪拌した。反応溶液に2Nの水酸化ナトリウム水溶液と飽和炭酸水素ナトリウム水を加えて塩基性とし、クロロホルムで抽出した。有機層を合わせて無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮し、得られた粗生成物をシリカゲルカラ

ムクロマトグラフィー（アンモニア飽和クロロホルム→アンモニア飽和クロロホルム→メタノール（100:1 →40:1））で精製すると、表題化合物 412 mg（収率50%）が得られた。メタノールより再結晶すると、結晶 140 mg が得られた。

[参考例 2 1]

参考例 2 0に記載の方法に準じ、アミド化の試薬として塩化フェニルアセチルの代わりに、塩化シクロブチルカルボニルを用いることによって、17-シクロブチルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5α-エポキシ-6,7,2',3'-(6',7'-ベンゾインドロ)モルヒナン3 1が得られた。

[参考例 2 2]

17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5α-エポキシ-6,7,2',3'-(5'-メチル-6',7'-ベンゾインドロ)モルヒナン3 2・メタンスルホン酸塩

17-シクロプロピルメチル-3,14β-ジヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5α-エポキシ-6,7,2',3'-(5'-メチル-6',7'-ベンゾインドロ)モルヒナン1 3 0.28 g を、無水DMF 7 ml に溶かし、炭酸カリウム 0.24 g、ヨウ化メチル 54.6 μl を加えて室温で4 時間反応させた。水 70 ml、エーテル 40 ml にあけて分液したが、有機層で析出が見られたので、酢酸エチル 30 ml を加えて抽出した。飽和食塩水 30 ml で洗浄後、乾燥、濃縮して得られた粗生成物を、中圧シリカゲルカラムクロマト（1回目:50 g;クロロホルム→クロロホルム/メタノール=30/1、2回目:50 g;クロロホルム→クロロホルム/メタノール=30/1）で精製すると、表題化合物の塩フリー体 273 mg が得られた。これをメタノール 10 ml、クロロホルム 5 ml に溶かし、メタンスルホン酸 34.1 μl を加えて塩化した。メタノール 5 ml×2 で共沸後、エーテルに懸濁して濾取すると、表題化合物 251 mg（収率73%）が得られた。

[参考例 2 3]

参考例 2 2に記載の方法に準じ、原料として17-シクロプロピルメチル-3,14β-ジヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5α-エポキシ-6,7,2',3'-(5'-メチル-6',7'-ベンゾインドロ)モルヒナン1 3の代

わりに、17-シクロプロピルメチル-3, 14 β -ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-インドロモルヒナン1を用いることによって、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-インドロモルヒナン33が得られた。

[実施例 11-13]

参考例 22 に記載の方法に準じ、原料として 17-シクロプロピルメチル-3, 14 β -ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(5'-メチル-6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン13の代わりに、17-シクロプロピルメチル-3, 14 β -ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(5', 6"-ベンゼノ-6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン19、17-シクロプロピルメチル-3, 14 β -ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(6', 7', 3", 2"-インデノインドロ)モルヒナン20、17-シクロプロピルメチル-3, 14 β -ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(5', 6"-エタノ-6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン3を用いることによって、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(1'-メチル-5', 6"-ベンゼノ-6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン34、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(6', 7', 3", 2"-インデノインドロ)モルヒナン35、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(5', 6"-エタノ-6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン36が得られた。

[参考例 24]

17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(1'-ベンジル-6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン37・メタンスルホン酸塩

17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5 α -エポキシ-6,7,2',3'-(6',7'-ベンゾインドロ)モルヒナン17 38.4 mg (0.463 mmol) をDMSO 0.4 ml に溶解し、この溶液に粉碎した粉末状水酸化カリウム 29.1 mg (0.441 mmol) を加え、室温にて5分間攪拌した後、臭化ベンジル 0.015 ml (0.126 mmol) を加え、室温にて30分間攪拌した。反応終了後、水 20 ml を加え、酢酸エチル (20 ml x 4) にて抽出した。有機層を合わせて、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (10 g : クロロホルム-メタノール (200:1 \rightarrow 100:1)) で精製すると、表題化合物の塩フリー体 33.3 mg (収率73%) が得られた。これをメタノールに溶解して、メタンスルホン酸を加えて塩として単離した。

[参考例 25-26]

参考例 24 に記載の方法に準じ、アルキル化剤として臭化ベンジルの代わりに、臭化4-フルオロベンジル、臭化4-メチルベンジルを用いることによって、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5 α -エポキシ-6,7,2',3'-[1'-(4-フルオロベンジル) インドロ] モルヒナン38、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5 α -エポキシ-6,7,2',3'-[1'-(4-メチルベンジル) インドロ] モルヒナン39が、それぞれ得られた。

[実施例 14]

参考例 24 に記載の方法に準じ、原料として17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5 α -エポキシ-6,7,2',3'-(6',7'-ベンゾインドロ) モルヒナン17の代わりに、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5 α -エポキシ-6,7,2',3'-(5',6"-ベンゼノ-6',7'-ベンゾインドロ) モルヒナン27を用いることによって、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5 α -エポキシ-6,7,2',3'-(1'-ベンジル-5',6"-

ベンゼノ-6', 7'-ベンゾインドロ) モルヒナン 4.0 が得られた。

[参考例 27]

17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-(2-フェニルエチル)-6', 7'-ベンゾインドロ] モルヒナン 4.1・メタンスルホン酸塩

17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-(6', 7'-ベンゾインドロ) モルヒナン 1.7 53.1 mg (0.111 mmol) をベンゼン 0.7 ml に溶解し、この溶液に p-トルエンスルホン酸 2-フェニルエチル 46.0 mg (0.17 mmol)、50%水酸化ナトリウム水溶液 0.2 ml、硫酸水素テトラブチルアンモニウム 18.8 mg (0.0554 mmol) を加え、室温で16時間攪拌した。さらに p-トルエンスルホン酸 2-フェニルエチル 46.0 mg (0.17 mmol) を追加し、40℃で 48時間攪拌した。反応混合物に水 5 ml を加え、酢酸エチル (5 ml x 4) で抽出した。有機層を合わせて、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (5 g:クロロホルム-メタノール (100:1)) で精製すると、表題化合物 64.6 mg (収率 100%) が得られた。これをメタノールに溶解して、メタンスルホン酸を加えて塩として単離した。

[参考例 28-29]

参考例 27 に記載の方法に準じ、アルキル化剤として p-トルエンスルホン酸 2-フェニルエチルの代わりに、ヨウ化メチルを用いることによって、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-メチル-6', 7'-ベンゾインドロ] モルヒナン 4.2 が、また、原料として 17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-(6', 7'-ベンゾインドロ) モルヒナン 1.7 の代わりに、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-インドロモルヒナン 3.3 を用い、アルキル化剤として塩化ベンジルを用いることによって、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-

4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(1'-ベンジルインドロ)モルヒナン43が、それぞれ得られた。

[実施例 15-21]

参考例 27 に記載の方法に準じ、アルキル化剤として p-トルエンスルホン酸 2-フェニルエチルの代わりに、p-トルエンスルホン酸 2-メトキシエチル、5-ブロモバレロニトリル、4-ブロモブチロニトリルを用いることによって、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-(2-メトキシエチル)-6', 7'-ベンゾインドロ]モルヒナン44、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-(4-シアノブチル)-6', 7'-ベンゾインドロ]モルヒナン45、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-(3-シアノプロピル)-6', 7'-ベンゾインドロ]モルヒナン46が、また、原料として 17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン17の代わりに、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(5'-メチル-6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン32を用い、アルキル化剤として 4-ブロモブチロニトリル、3-ブロモプロピルアミン・臭化水素酸塩を用いることによって、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-(3-シアノプロピル)-5'-メチル-6', 7'-ベンゾインドロ]モルヒナン47、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-(3-アミノプロピル)-5'-メチル-6', 7'-ベンゾインドロ]モルヒナン48が、さらに、原料として 17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(5', 6"-エタノ-6'

、7'-ベンゾインドロ) モルヒナン 3.6 を用い、アルキル化剤として塩化ベンジル、ヨウ化メチルを用いることによって、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5 α -エポキシ-6,7,2',3'-(1'-ベンジル-5',6"-エタノ-6',7'-ベンゾインドロ) モルヒナン 4.9、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5 α -エポキシ-6,7,2',3'-(1'-メチル-5',6"-エタノ-6',7'-ベンゾインドロ) モルヒナン 5.0 が、それぞれ得られた。

[実施例 2.2]

17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5 α -エポキシ-6,7,2',3'-(1'-ベンゾイルインドロ) モルヒナン 5.1・メタンスルホン酸塩

17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5 α -エポキシ-6,7,2',3'-インドロモルヒナン 3.3 285 mg をジクロロエタン 5.7 ml に溶解し、粉末状に粉碎した水酸化ナトリウム 72.6 mg、硫酸水素テトラブチルアンモニウム 2.5 mg を加えた後、塩化ベンゾイル 0.12 ml を加えて、室温で 6.5 時間攪拌した。さらに粉末状水酸化ナトリウム 44.9 mg、塩化ベンゾイル 0.06 ml を加えて、室温で 2.5 日間攪拌した。反応液に水 8 ml を加えて分液し、水層をクロロホルム 5 ml で抽出した。有機層を合わせて乾燥、濃縮し、得られた粗生成物 389 mg をシリカゲルカラムクロマト (1回目: 25 g; クロロホルム-メタノール (50:1)、2回目: 20 g; クロロホルム-メタノール (100:1)) で精製すると、表題化合物の塩フリー体 220 mg が得られた。これをクロロホルム-メタノールに溶解し、メタンスルホン酸を加えて塩化し、濃縮後に得られた固体を酢酸エチルに懸濁して濾取すると、表題化合物 227 mg (収率54%) が得られた。

[実施例 2.3]

17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5 α -エポキシ-6,7,2',3'-(1'-メチルスルホニル-6',7'-ベンゾインドロ) モルヒナン 5.2・メタンスルホン酸塩

水素化ナトリウム (60%) 120 mg を無水THFに懸濁し、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン17 453 mg のTHF溶液 (10 + 5 ml) を加え、100 °Cで 30 分間攪拌した。室温に冷却した後、塩化メタンスルホン 88 μ l を加えて、20分間攪拌した。反応溶液に水 50 ml を加えて、クロロホルム (50 ml \times 2) で抽出し、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。得られた粗生成物を、中圧シリカゲルカラムクロマトグラフィー (シクロヘキサン:酢酸=2:1) で精製した後、酢酸エチルから再結晶すると、表題化合物の塩フリー体 211 mg (収率40%) が得られた。これをメタンスルホン酸塩に変換して単離した。

[実施例 24-28]

実施例 23 に記載の方法に準じ、原料として17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン17の代わりに、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(6'-フェニルインドロ)モルヒナン、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(5', 6"-ベンゼノ-6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン27、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-インドロモルヒナン33を用いることによって、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(1'-メチルスルホン-6'-フェニルインドロ)モルヒナン53、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(1'-メチルスルホン-5', 6"-ベンゼノ-6', 7'-ベンゾインドロ)モルヒナン54、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(1'-メチルスルホンインドロ)モルヒナン55が

、また、原料として17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5α-エポキシ-6,7,2',3'-インドロモルヒナン33を用い、スルホニル化剤として塩化メタンスルホニルの代わりに、塩化p-トルエンスルホニル、塩化α-トルエンスルホニルを用いることによって、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5α-エポキシ-6,7,2',3'-[1'-(4-トリルスルホニル)インドロ]モルヒナン56、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5α-エポキシ-6,7,2',3'-(1'-ベンジルスルホニルインドロ)モルヒナン57が、それぞれ得られた。

[実施例29]

実施例23に記載の方法に準じ、原料として17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5α-エポキシ-6,7,2',3'-(6',7'-ベンゾインドロ)モルヒナン17の代わりに、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5α-エポキシ-6,7,2',3'-インドロモルヒナン33を用い、スルホニル化剤である塩化メタンスルホニルの代わりに、アシル化剤である塩化アセチルを用いることによって、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5α-エポキシ-6,7,2',3'-(1'-アセチルインドロ)モルヒナン58が得られた。

[実施例30]

17-シクロプロピルメチル-3,14β-ジヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5α-エポキシ-6,7,2',3'-[1'-(3-イソチオシアナトプロピル)インドロ]モルヒナン59・メタンスルホン酸塩

17-シクロプロピルメチル-3,14β-ジヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5α-エポキシ-6,7,2',3'-[1'-(3-アミノプロピル)インドロ]モルヒナン24 241 mg をジクロロメタン 4 ml に溶解し、ジ-2-ピリジルチオノカルボナート 120 mg を加え、室温で 15 分間攪拌した。反応溶液にアンモニア飽和クロロホルム 4 ml を加えて 5 分間攪拌した後、この有機層

を水 (4 ml×2) で洗浄し、乾燥、濃縮した。得られた粗生成物 253 mg をシリカゲルカラムクロマト (25 g ; クロロホルム-メタノール (50:1→30:1)) で精製すると、表題化合物の塩フリー体 227 mg が得られた。これをクロロホルム-メタノールに溶解し、メタンスルホン酸を加えて塩化し、濃縮後に得られた固体を酢酸エチルに懸濁して濾取すると、表題化合物 240 mg (収率77%) が得られた。

〔実施例 3 1〕

実施例 3 0 に記載の方法に準じ、原料として 1 7-シクロプロピルメチル-3, 1 4 β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (3-アミノプロピル) インドロ] モルヒナン 2 4 の代わりに、1 7-シクロプロピルメチル-3, 1 4 β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (3-アミノプロピル) -6', 7' -ベンゾインドロ] モルヒナン 2 5 を用いることによって、1 7-シクロプロピルメチル-3, 1 4 β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (3-イソチオシアナトプロピル) -6', 7' -ベンゾインドロ] モルヒナン 6 0 が得られた。

〔実施例 3 2〕

1 7-シクロプロピルメチル-3, 1 4 β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (3-ベンズアミドプロピル) インドロ] モルヒナン 6 1・塩酸塩

1 7-シクロプロピルメチル-3, 1 4 β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (3-アミノプロピル) インドロ] モルヒナン 2 4 229 mg をクロロホルム 3.5 ml に溶解し、トリエチルアミン 0.203 ml および塩化ベンゾイル 0.118 ml を加え、室温で1時間攪拌した。反応溶液を一旦濃縮後、メタノール 3 ml に溶解し、3 N 水酸化ナトリウム水溶液 1 ml を加えて室温で40分間攪拌した。この反応溶液を濃縮して水 5 ml を加え、クロロホルム (5 ml×2) で抽出し、有機層を合わせて乾燥し、濃縮した。得られた粗生成物 279 mg をシリカゲルカラムクロマト (20 g ; クロロホルム-メタノール (20:1)) で精製すると、表題化合物の塩フリー体 266 mg が得られた。これをメタノールに溶解し、塩化水素のメタノール溶液を加えて塩化し

、濃縮後に得られた固体を酢酸エチルに懸濁して濾取すると、表題化合物 199 mg (収率67%) が得られた。

[実施例 33-38]

実施例 32 に記載の方法に準じ、アシル化剤として塩化ベンゾイルの代わりに、塩化 6-フェニルヘキサノイル、塩化 3-トリフルオロメチルシンナモイルを用いることによって、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-[3-(6-フェニルヘキサノアミド)プロピル]インドロ]モルヒナン62、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-[3-(3-トリフルオロメチルシンナムアミド)プロピル]インドロ]モルヒナン63が、また、原料の17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-(3-アミノプロピル)インドロ]モルヒナン24の代わりに、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-(3-アミノプロピル)-6', 7'-ベンゾインドロ]モルヒナン25を用い、アシル化剤として塩化ベンゾイル、塩化 3-トリフルオロメチルシンナモイル、塩化ニコチノイル、イソチオシアン酸ベンジルを用いことによって、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-(3-ベンズアミドプロピル)-6', 7'-ベンゾインドロ]モルヒナン64、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-[3-(3-トリフルオロメチルシンナムアミド)プロピル]-6', 7'-ベンゾインドロ]モルヒナン65、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-(3-ニコチンアミドプロピル)-6', 7'-ベンゾインドロ]モルヒナン66、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-[3-(N'-ベンジルチオウレイド)プロピル]-6', 7'-ベ

ンゾインドロ] モルヒナン 67 が、それぞれ得られた。

[参考例 30]

17-シクロプロピルメチル-3, 14 β -ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(1'-ベンジルインドロ) モルヒナン 68・メタンスルホン酸塩

17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(1'-ベンジルインドロ) モルヒナン 43 160 mg をジクロロメタン 8 ml に溶解し、0℃に冷却した後、三臭化ホウ素の 1.0 M ジクロロメタン溶液 1.2 ml を滴下し、0℃で1時間攪拌した。反応溶液に水 30 ml とアンモニア水 5 ml を加え、クロロホルム 50 ml \times 2 で抽出した。有機層を合わせて無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮し、得られた粗生成物を中圧シリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム-メタノール (50:1)）で精製すると、表題化合物の塩フリー体 112 mg（収率72%）が得られた。これをメタンスルホン酸塩として単離した。

[参考例 31-38]

参考例 30に記載の方法に準じ、原料として17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(1'-ベンジルインドロ) モルヒナン 43の代わりに、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(1'-ベンジル-6', 7'-ベンゾインドロ) モルヒナン 37、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-(4-フルオロベンジル) インドロ] モルヒナン 38、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-(4-メチルベンジル) インドロ] モルヒナン 39、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(1'-メチル-6', 7'-ベンゾインドロ) モルヒナン 42、3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7

, 2', 3' - (6', 7' - ベンゾインドロ) モルヒナン 28、17 - メチル - 3 - メトキシ - 14 β - ヒドロキシ - 6, 7 - デヒドロ - 4, 5 α - エポキシ - 6, 7, 2', 3' - (6', 7' - ベンゾインドロ) モルヒナン 29、17 - (2 - フェニルエチル) - 3 - メトキシ - 14 β - ヒドロキシ - 6, 7 - デヒドロ - 4, 5 α - エポキシ - 6, 7, 2', 3' - (6', 7' - ベンゾインドロ) モルヒナン 30、17 - シクロブチルメチル - 3 - メトキシ - 14 β - ヒドロキシ - 6, 7 - デヒドロ - 4, 5 α - エポキシ - 6, 7, 2', 3' - (6', 7' - ベンゾインドロ) モルヒナン 31を用いることによって、17 - シクロプロピルメチル - 3, 14 β - ジヒドロキシ - 6, 7 - デヒドロ - 4, 5 α - エポキシ - 6, 7, 2', 3' - (1' - ベンジル - 6', 7' - ベンゾインドロ) モルヒナン 69、17 - シクロプロピルメチル - 3, 14 β - ジヒドロキシ - 6, 7 - デヒドロ - 4, 5 α - エポキシ - 6, 7, 2', 3' - [1' - (4 - フルオロベンジル) インドロ] モルヒナン 70、17 - シクロプロピルメチル - 3, 14 β - ジヒドロキシ - 6, 7 - デヒドロ - 4, 5 α - エポキシ - 6, 7, 2', 3' - [1' - (4 - メチルベンジル) インドロ] モルヒナン 71、17 - シクロプロピルメチル - 3, 14 β - ジヒドロキシ - 6, 7 - デヒドロ - 4, 5 α - エポキシ - 6, 7, 2', 3' - (1' - メチル - 6', 7' - ベンゾインドロ) モルヒナン 72、3, 14 β - ジヒドロキシ - 6, 7 - デヒドロ - 4, 5 α - エポキシ - 6, 7, 2', 3' - (6', 7' - ベンゾインドロ) モルヒナン 73、17 - メチル - 3, 14 β - ジヒドロキシ - 6, 7 - デヒドロ - 4, 5 α - エポキシ - 6, 7, 2', 3' - (6', 7' - ベンゾインドロ) モルヒナン 74、17 - (2 - フェニルエチル) - 3, 14 β - ジヒドロキシ - 6, 7 - デヒドロ - 4, 5 α - エポキシ - 6, 7, 2', 3' - (6', 7' - ベンゾインドロ) モルヒナン 75、17 - シクロブチルメチル - 3, 14 β - ジヒドロキシ - 6, 7 - デヒドロ - 4, 5 α - エポキシ - 6, 7, 2', 3' - (6', 7' - ベンゾインドロ) モルヒナン 76が、それぞれ得られた。

[実施例 39 - 48]

参考例 30 に記載の方法に準じ、原料として 17 - シクロプロピルメチル - 3 - メトキシ - 14 β - ヒドロキシ - 6, 7 - デヒドロ - 4, 5 α - エポキシ - 6

, 7, 2', 3' - (1' - ベンジルインドロ) モルヒナン 43 の代わりに、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - (1' - メチル-5', 6'' - ベンゼノ-6', 7' - ベンゾインドロ) モルヒナン 34、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - (1' - メチルスルホニル-6', 7' - ベンゾインドロ) モルヒナン 52、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - (1' - ベンジル-5', 6'' - ベンゼノ-6', 7' - ベンゾインドロ) モルヒナン 40、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (2-フェニルエチル) - 6', 7' - ベンゾインドロ] モルヒナン 41、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (2-メトキシエチル) - 6', 7' - ベンゾインドロ] モルヒナン 44、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (4-シアノブチル) - 6', 7' - ベンゾインドロ] モルヒナン 45、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - (1' - ベンジル-5', 6'' - エタノ-6', 7' - ベンゾインドロ) モルヒナン 49、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - (1' - メチル-5', 6'' - エタノ-6', 7' - ベンゾインドロ) モルヒナン 50、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (3-シアノプロピル) - 6', 7' - ベンゾインドロ] モルヒナン 46、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (3-シアノプロピル) - 5' - メチル-6', 7' - ベンゾインドロ] モルヒナン 47 を用いることによって、17-

シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - (1'-メチル-5', 6"-ベンゼノ-6', 7'-ベンゾインドロ) モルヒナン77、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - (1'-メチルスルホニル-6', 7'-ベンゾインドロ) モルヒナン78、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - (1'-ベンジル-5', 6"-ベンゼノ-6', 7'-ベンゾインドロ) モルヒナン79、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (2-フェニルエチル) -6', 7'-ベンゾインドロ] モルヒナン80、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (2-ヒドロキシエチル) -6', 7'-ベンゾインドロ] モルヒナン81、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (4-シアノブチル) -6', 7'-ベンゾインドロ] モルヒナン82、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - (1'-ベンジル-5', 6"-エタノ-6', 7'-ベンゾインドロ) モルヒナン83、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - (1'-メチル-5', 6"-エタノ-6', 7'-ベンゾインドロ) モルヒナン84、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (3-シアノプロピル) -6', 7'-ベンゾインドロ] モルヒナン85、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (3-シアノプロピル) -5'-メチル-6', 7'-ベンゾインドロ] モルヒナン86が、それぞれ得られた。

[実施例 49-50]

参考例 27 に記載の方法に準じ、原料として 17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(6', 7'-ベンゾインドロ) モルヒナン 17 の代わりに、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(5'-メチル-6', 7'-ベンゾインドロ) モルヒナン 32 を用い、アルキル化剤として p-トルエンスルホン酸 2-フェニルエチルの代わりに、4-ブロモブチロニトリル、4-ブロモ酪酸エチルを用いることによって、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-(4-シアノブチル)-5'-メチル-6', 7'-ベンゾインドロ] モルヒナン 87、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-[3-(エトキシカルボニル)プロピル]-5'-メチル-6', 7'-ベンゾインドロ] モルヒナン 88 が、それぞれ得られた。

[実施例 51-52]

参考例 30 に記載の方法に準じ、原料として 17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-(1'-ベンジルインドロ) モルヒナン 43 の代わりに、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-(3-アミノプロピル)-5'-メチル-6', 7'-ベンゾインドロ] モルヒナン 48、17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14 β -ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-(4-シアノブチル)-5'-メチル-6', 7'-ベンゾインドロ] モルヒナン 87 を用いることによって、17-シクロプロピルメチル-3, 14 β -ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -エポキシ-6, 7, 2', 3'-[1'-(3-アミノプロピル)-5'-メチル-6', 7'-ベンゾインドロ] モルヒナン 89、17-シクロプロピルメチル-3, 14 β -ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5 α -

エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (4-シアノブチル) - 5' - メチル-6', 7' - ベンゾインドロ] モルヒナン 90 が、それぞれ得られた。

[実施例 53]

実施例 30 に記載の方法に準じ、原料として 17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (3-アミノプロピル) インドロ] モルヒナン 24 の代わりに、

17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (3-アミノプロピル) - 5' - メチル-6', 7' - ベンゾインドロ] モルヒナン 89 を用いることによって、17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (3-イソチオシアナトプロピル) - 5' - メチル-6', 7' - ベンゾインドロ] モルヒナン 91 が得られた。

[実施例 54]

17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (3-ホルムアミドプロピル) - 6', 7' - ベンゾインドロ] モルヒナン 92・メタンスルホン酸塩

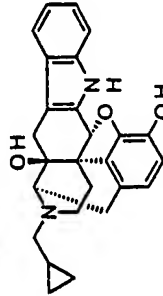
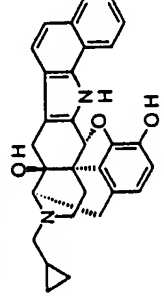
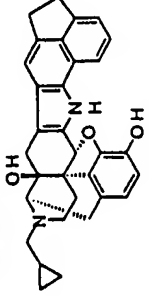
17-シクロプロピルメチル-3, 14β-ジヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (3-アミノプロピル) - 6', 7' - ベンゾインドロ] モルヒナン 25 1.7 g (3.26 mmol) をギ酸エチル 30 ml とエタノール 20 ml に溶解し、25 時間加熱還流した。反応混合物を濃縮し、得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (100 g : ASC/メタノール : 50/1 → 20/1) で精製すると、表題化合物の塩フリー体 1.31 g (66%) が得られた。これをメタンスルホン酸塩として単離した。

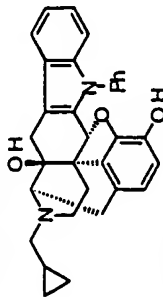
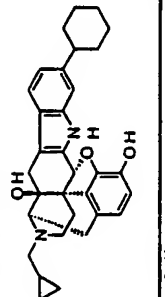
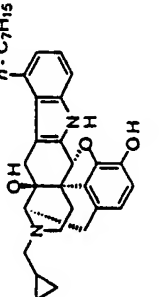
[実施例 55]

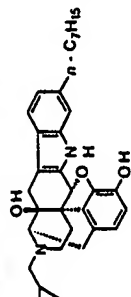
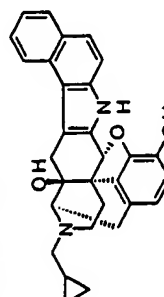
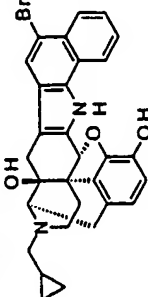
17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6, 7-デヒドロ-4, 5α-エポキシ-6, 7, 2', 3' - [1' - (3-カルボキシプロピル) - 6', 7' - ベンゾインドロ] モルヒナン 93

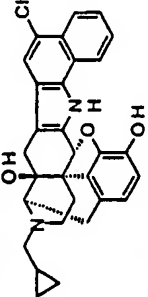
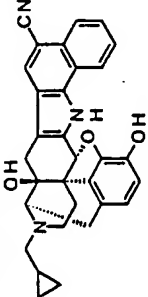
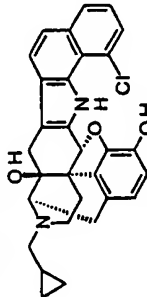
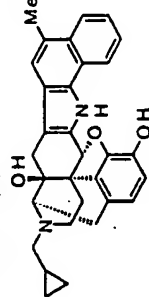
17-シクロプロピルメチル-3-メトキシ-14β-ヒドロキシ-6,7-デヒドロ-4,5α-エポキシ-6,7,2',3'-[1'-(3-シアノプロピル)-6',7'-ベンゾインドロ]モルヒナン 4674.8 mg (0.137 mmol) をメタノール 3 ml とテトラヒドロフラン 8 ml に溶解し、この溶液に 2 N 水酸化ナトリウム水溶液を 2 ml 加え、98 時間加熱還流した。反応混合物に水 30 ml を加え、クロロホルム (40 ml x 3) で抽出した。有機層を合わせて、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮し、得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (10 g : クロロホルム/メタノール : 50/1 → 20/1 → 10/1 → 1/1) で精製すると、表題化合物 66 mg (85%) が得られた。

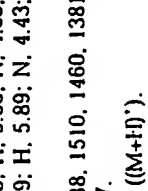
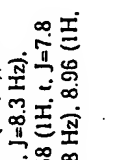
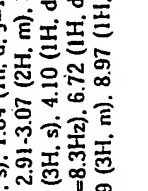
以上の各参考例、実施例で挙げた本発明の化合物の構造式、酸付加塩、製造収率、各種スペクトルデータを、以下の一覧表に示す。

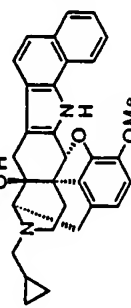
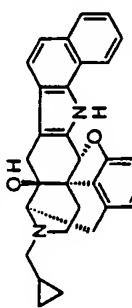
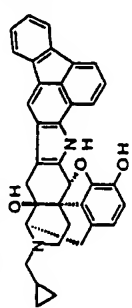
<p>化合物 1 メタンスルホン酸塩 収率 68 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.43 (m, 1H), 0.49 (m, 1H), 0.62 (m, 1H), 0.73 (m, 1H), 1.10 (m, 1H), 1.82 (br d, 1H, J=11.2 Hz), 2.31 (s, 3H), 2.54 (d, 1H, J=16.1 Hz), 2.60 (m, 1H), 2.71 (m, 1H), 2.94 (m, 1H), 2.95 (d, 1H, J=16.1 Hz), 3.12 (m, 1H), 3.25 (dd, 1H, J=20.0, 6.3 Hz), 3.37 (m, 1H), 3.44 (d, 1H, J=20.0 Hz), 4.08 (d, 1H, J=6.3 Hz), 5.69 (s, 1H), 6.33 (s, 1H, OH), 6.59 (d, 1H, J=8.1 Hz), 6.64 (d, 1H, J=8.1 Hz), 6.97 (dd, 1H, J=7.8 Hz), 7.11 (dd, 1H, J=8.3, 7.8 Hz), 7.35 (d, 1H, J=7.8 Hz), 7.36 (d, 1H, J=8.3 Hz), 8.92 (m, 1H, NH), 9.22 (s, 1H, OH), 11.32 (s, 1H, NH).</p>	<p>融点 (未測定) (°C). 元素分析値 組成式 C₂₄H₂₄N₂O₃·MeSO₃H·0.31H₂O 計算値 C, 62.85; H, 5.95; N, 5.43; S, 6.21. 実測値 C, 62.88; H, 6.24; N, 5.44; S, 6.24. IR (cm⁻¹) (KBr) (塩フリー体のデータ). 3392, 2926, 2838, 1638, 1622, 1504, 1458. Mass (FAB) 415 ((M+H)⁺).</p>
<p>化合物 2 塩酸塩 収率 56 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.45 (1H, m), 0.51 (1H, m), 0.64 (1H, m), 0.74 (1H, m), 1.11 (1H, m), 1.86 (1H, br d, J=11.7 Hz), 2.63 (1H, d, J=16.1 Hz), 2.65-2.80 (2H, m), 2.96 (1H, m), 3.06 (1H, d, J=16.1 Hz), 3.12 (1H, m), 3.25-3.40 (2H, m), 3.46 (1H, d, J=20.0 Hz), 4.12 (1H, d, J=6.4 Hz), 5.80 (1H, s), 6.43 (1H, s), 6.60 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.66 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.41 (1H, t, J=7.8 Hz), 7.43 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.48 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.55 (1H, t, J=7.8 Hz), 7.90 (1H, d, J=8.3 Hz), 8.44 (1H, d, J=8.3 Hz), 8.98 (1H, br s), 9.26 (1H, s), 12.30 (1H, s).</p>	<p>融点 190 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₀H₂₄N₂O₃·HCl·0.51H₂O 計算値 C, 70.65; H, 5.93; N, 5.49; Cl, 6.95. 実測値 C, 70.42; H, 5.97; N, 5.63; Cl, 6.79. IR (cm⁻¹) (KBr) 3210, 1638, 1620, 1504, 1462, 1427, 1390, 1317, 1245, 1172, 1116, 855, 810, 750. Mass (FAB) 465 ((M+H)⁺).</p>
<p>化合物 3 メタンスルホン酸塩 収率 66 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.45 (m, 1H), 0.51 (m, 1H), 0.63 (m, 1H), 0.75 (m, 1H), 1.12 (m, 1H), 1.83 (m, 1H), 2.30 (s, 3H), 2.61 (d, 1H, J=15.8 Hz), 2.62 (m, 1H), 2.73 (m, 1H), 2.93 (m, 1H), 3.01 (d, 1H, J=15.8 Hz), 3.12 (m, 1H), 3.23-3.49 (m, 7H), 4.09 (br d, J=6.8 Hz), 5.78 (s, 1H), 6.37 (s, 1H, OH), 6.60 (d, 1H, J=8.3 Hz), 6.64 (d, 1H, J=8.3 Hz), 7.21 (s, 1H), 7.23 (d, 1H, J=7.8 Hz), 7.47 (dd, 1H, J=7.8, 7.8 Hz), 8.02 (d, 1H, J=7.8 Hz), 8.93 (m, 1H, NH), 9.20 (s, 1H, OH), 12.12 (s, 1H, NH).</p>	<p>融点 >260 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₂H₂₄N₂O₃·CH₃SO₃H·0.41H₂O 計算値 C, 66.74; H, 5.91; N, 4.72; S, 5.40. 実測値 C, 66.63; H, 6.12; N, 4.68; S, 5.39. IR (cm⁻¹) (KBr) 3570, 1638, 1626, 1508, 1460, 1408, 1328, 1199, 1152, 1044, 928, 861, 779. Mass (FAB) 490 ((M+H)⁺).</p>

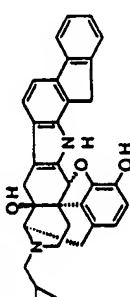
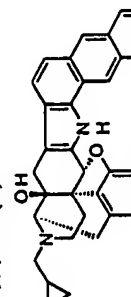
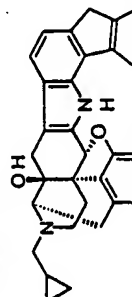
化合物 4 メタンスルホン酸塩 収率 43 (%)		NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.40-0.53 (2H, m), 0.64 (1H, m), 0.75 (1H, m), 1.10 (1H, m), 1.78 (1H, br d, J=10.7 Hz), 2.29 (3H, s), 2.57 (1H, m), 2.64 (1H, d, J=16.1 Hz), 2.71 (1H, m), 2.96 (1H, m), 3.03 (1H, d, J=16.1 Hz), 3.10 (1H, m), 3.25-3.42 (2H, m), 3.46 (1H, d, J=20.0 Hz), 4.13 (1H, d, J=6.8 Hz), 5.62 (1H, s), 6.40 (1H, s), 6.62 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.65 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.11 (1H, dd, J=7.8, 2.0 Hz), 7.15-7.22 (2H, m), 7.48 (1H, d, J=7.8 Hz), 7.55 (1H, m), 7.63-7.70 (4H, m), 8.94 (1H, br s), 9.20 (1H, s).	融点 220 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 $C_{22}H_{21}N_2O_3 \cdot ClH_3SO_3H \cdot 0.4H_2O$ 計算値 C, 66.74; H, 5.91; N, 4.72; S, 5.40. 実測値 C, 66.81; H, 6.05; N, 4.69; S, 5.30. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 2928, 1502, 1460, 1377, 1187, 1116, 1044, 934, 845, 748. Mass (FAB) 491 (M+H)⁺.
化合物 5 メタンスルホン酸塩 収率 16 (%)		NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.39-0.55 (2H, m), 0.58-0.78 (2H, m), 1.03-1.16 (1H, m), 1.18-1.31 (1H, m), 1.30-1.50 (4H, m), 1.71 (1H, br d, J=11.7 Hz), 1.71-1.87 (5H, m), 2.30 (3H, s), 2.61 (1H, dt, J=4.4, 13.2 Hz), 2.64-2.77 (1H, m), 2.85-2.98 (2H, m), 3.10 (1H, br d, J=10.3 Hz), 3.25 (1H, dd, J=6.6, 19.8 Hz), 4.07 (1H, d, J=6.3 Hz), 5.66 (1H, s), 6.28 (1H, br s), 6.58 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.63 (1H, d, J=7.8 Hz), 6.86 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.15 (1H, s), 7.23 (1H, d, J=8.3 Hz), 8.91 (1H, br s), 9.20 (1H, br s), 11.16 (1H, s).	融点 180 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 $C_{22}H_{21}N_2O_3 \cdot ClH_3SO_3H \cdot 0.8H_2O$ 計算値 C, 65.28; H, 6.91; N, 4.61; S, 5.28. 実測値 C, 65.18; H, 6.73; N, 4.79; S, 5.38. IR (cm⁻¹) (KBr) 3395, 3280, 2924, 2852, 1462, 1330, 1210, 1168, 1114, 1044, 861, 777. Mass (FAB) 497 (M+H)⁺.
化合物 6 メタンスルホン酸塩 収率 20 (%)		NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.39-0.56 (2H, m), 0.59-0.78 (2H, m), 0.85 (3H, t, J=6.8 Hz), 1.07-1.38 (9H, m), 1.43-1.64 (2H, m), 1.81 (1H, br d, J=11.2 Hz), 2.30 (3H, s), 2.59 (1H, dt, J=4.4, 13.2 Hz), 2.65-2.76 (1H, m), 2.74 (1H, d, J=15.6 Hz), 2.76-2.85 (2H, m), 2.86-2.96 (1H, m), 3.11 (1H, br s), 3.16 (1H, d, J=16.1 Hz), 3.24 (1H, dd, J=6.6, 19.8 Hz), 4.04 (1H, d, J=6.8 Hz), 5.66 (1H, s), 6.37 (1H, br s), 6.59 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.63 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.70 (1H, d, J=7.3 Hz), 6.98 (1H, t, J=7.6 Hz), 7.17 (1H, d, J=7.8 Hz), 8.91 (1H, br s), 9.21 (1H, br s), 11.31 (1H, s).	融点 195 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 $C_{23}H_{21}N_2O_3 \cdot ClH_3SO_3H \cdot 0.31H_2O$ 計算値 C, 66.49; H, 7.32; N, 4.56; S, 5.22. 実測値 C, 66.38; H, 7.27; N, 4.67; S, 5.32. IR (cm⁻¹) (KBr) 3258, 2930, 2858, 1640, 1622, 1464, 1331, 1194, 1116, 1045, 779, 553. Mass (FAB) 512 (M+H)⁺.

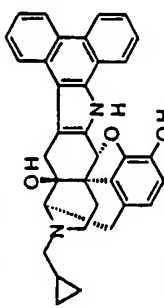
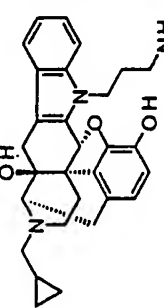
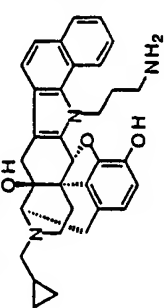
<p>化合物 7 メタンスルホン酸塩 収率 51 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.38-0.54(2H, m), 0.57-0.67(1H, m), 0.68-0.77(1H, m), 0.84(3H, t, J=6.8Hz), 1.03-1.16(1H, m), 1.15-1.33(8H, m), 1.48-1.62(2H, m), 1.81(1H, br d, J=11.2Hz), 2.31(3H, s), 2.47-2.77(4H, m), 2.87-2.98(1H, m), 2.91(1H, d, J=16.1Hz), 3.10(1H, br d, J=10.8Hz), 3.25(1H, dd, J=6.6, 19.8Hz), 3.33-3.42(1H, m), 3.43(1H, d, J=20.0Hz), 4.07(1H, d, J=6.8Hz), 5.66(1H, s), 6.30(1H, br s), 6.58(1H, d, J=8.3Hz), 6.63(1H, d, J=7.8Hz), 6.82(1H, d, J=7.8Hz), 7.13(1H, s), 7.23(1H, d, J=8.3Hz), 8.91(1H, br s), 9.19(1H, br s), 11.15(1H, s).</p>	<p>融点 160 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₃H₄₆N₂O₃·CH₃SO₃H·0.4H₂O 計算値 C, 66.29; H, 7.33; N, 4.55; S, 5.21. 実測値 C, 66.37; H, 7.20; N, 4.60; S, 5.19. IR (cm⁻¹) (KBr) 3240, 2928, 2856, 1626, 1510, 1462, 1330, 1210, 1195, 1114, 1044, 928, 866, 818, 785. Mass (FAB) 513 (M+H⁺).</p>
<p>化合物 8 メタンスルホン酸塩 収率 35 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, CD₃OD) 0.52-0.60(2H, m), 0.76-0.84(1H, m), 0.87-0.94(1H, m), 1.15-1.22(1H, m), 1.95-2.01(1H, m), 2.69(3H, s), 2.74-2.83(1H, m), 2.92-3.04(2H, m), 3.13(1H, d, J=16.2 Hz), 3.16-3.23(1H, m), 3.35-3.42(1H, m), 3.45-3.50(2H, m), 3.58(1H, d, J=16.2 Hz), 4.29(1H, br s), 5.81(1H, s), 6.67(1H, d, J=8.0 Hz), 6.70(1H, d, J=8.0 Hz), 7.29-7.34(1H, m), 7.42-7.47(1H, m), 7.52(1H, d, J=5.0 Hz), 7.55(1H, d, J=5.0 Hz), 7.84(1H, d, J=8.0 Hz), 8.24(1H, d, J=8.0 Hz).</p>	<p>融点 245 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₀H₂₄N₂O₃·CH₃SO₃H·0.3H₂O 計算値 C, 65.78; H, 5.80; N, 4.95; S, 5.66. 実測値 C, 65.61; H, 5.86; N, 5.00; S, 5.59. IR (cm⁻¹) (KBr) 3300, 1620, 1504, 1462, 1363, 1330, 1207, 1116, 1046, 862, 806. Mass (FAB) 465 (M+H⁺).</p>
<p>化合物 9 メタンスルホン酸塩 収率 58 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.45(1H, m), 0.52(1H, m), 0.65(1H, m), 0.74(1H, m), 1.12(1H, m), 1.86(1H, d, J=11.7 Hz), 2.30(3H, s), 2.60-2.80(3H, m), 2.95(1H, m), 3.04(1H, d, J=16.1 Hz), 3.14(1H, m), 3.20-3.50(3H, m), 4.08(1H, d, J=6.8 Hz), 5.80(1H, s), 6.40(1H, br), 6.61(1H, d, J=8.3 Hz), 6.65(1H, d, J=8.3 Hz), 7.58(1H, t, J=8.3 Hz), 7.67(1H, t, J=8.3 Hz), 7.87(1H, s), 8.15(1H, d, J=8.3 Hz), 8.50(1H, d, J=8.3 Hz), 8.99(1H, br), 9.25(1H, br), 12.52(1H, s).</p>	<p>融点 275-285 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₀H₂₂N₂O₃Br·CH₃SO₃H·0.11H₂O 計算値 C, 58.05; H, 4.90; N, 4.37; Br, 12.46; S, 5.00. 実測値 C, 58.04; H, 5.09; N, 4.54; Br, 12.43; S, 4.99. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 3200, 1632, 1620, 1508, 1460, 1354, 1330, 1199, 1116, 1044, 917. Mass (FAB) 543 (M+H⁺).</p>

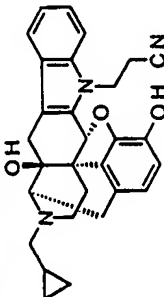
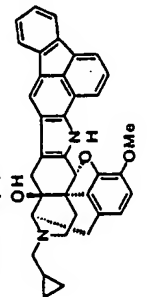
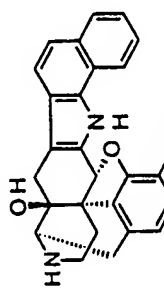
化合物 10 メタンスルホン酸塩 収率 85 (%)		NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.45 (1H, m), 0.52 (1H, m), 0.64 (1H, m), 0.74 (1H, m), 1.12 (1H, m), 1.87 (1H, d, J=12.7 Hz), 2.30 (3H, s), 2.60-2.80 (3H, m), 2.95 (1H, m), 3.03 (1H, d, J=16.1 Hz), 3.14 (1H, m), 3.20-3.50 (3H, m), 4.08 (1H, d, J=6.4 Hz), 5.80 (1H, s), 6.41 (1H, br), 6.61 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.65 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.57 (1H, t, J=7.3 Hz), 7.68 (1H, t, J=7.5 Hz), 7.69 (1H, s), 8.19 (1H, d, J=8.3 Hz), 8.52 (1H, d, J=8.3 Hz), 8.96 (1H, br), 9.25 (1H, br), 12.51 (1H, s).	融点 275-285 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C ₂₄ H ₂₇ N ₂ O ₃ Cl·CH ₃ SO ₃ H·0.2H ₂ O 計算値 C, 62.19; H, 5.29; N, 4.68; Cl, 5.92; S, 5.36. 実測値 C, 61.80; H, 5.58; N, 4.93; Cl, 5.95; S, 5.43. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 3200, 1632, 1620, 1510, 1460, 1357, 1330, 1202, 1116, 1044, 857. Mass (FAB) 499 (M+H)⁺.
化合物 11 メタンスルホン酸塩 収率 80 (%)		NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.46 (1H, m), 0.52 (1H, m), 0.65 (1H, m), 0.75 (1H, m), 1.13 (1H, m), 1.88 (1H, d, J=11.7 Hz), 2.32 (3.15H, s), 2.60-2.80 (3H, m), 2.96 (1H, m), 3.14 (1H, d, J=14.2 Hz), 3.17 (1H, m), 3.20-3.50 (3H, m), 4.10 (1H, d, J=6.3 Hz), 5.82 (1H, s), 6.45 (1H, br), 6.62 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.66 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.68 (1H, t, J=8.3 Hz), 7.75 (1H, t, J=6.8 Hz), 8.11 (1H, d, J=7.8 Hz), 8.24 (1H, s), 8.60 (1H, d, J=8.3 Hz), 8.97 (1H, br), 9.26 (1H, br), 12.91 (1H, s).	融点 260-280 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C ₂₄ H ₂₇ N ₂ O ₃ ·1.05Cl ₃ SO ₃ H·0.71H ₂ O 計算値 C, 63.83; H, 5.45; N, 6.97; S, 5.58. 実測値 C, 63.92; H, 5.57; N, 6.80; S, 5.62. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 3200, 2218, 1630, 1620, 1508, 1460, 1375, 1330, 1209, 1116, 1046. Mass (FAB) 490 (M+H)⁺.
化合物 12 メタンスルホン酸塩 収率 60 (%)		NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.41-0.56 (2H, m), 0.58-0.69 (1H, m), 0.69-0.79 (1H, m), 1.04-1.16 (1H, m), 1.88 (1H, d, J=12 Hz), 2.56-2.69 (2H, m), 2.69-2.83 (1H, m), 2.89-3.00 (1H, m), 3.06 (1H, d, J=16 Hz), 3.08-3.18 (1H, m), 3.22-3.35 (1H, m), 3.36-3.47 (2H, m), 4.11 (1H, d, J=6.4 Hz), 5.90 (1H, s), 6.40 (1H, br s), 6.61 (1H, d, J=7.8 Hz), 6.65 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.43 (1H, t, J=7.8 Hz), 7.57 (1H, d, J=7.8 Hz), 7.62 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.66 (1H, d, J=7.3 Hz), 7.95 (1H, d, J=7.8 Hz), 8.97 (1H, br s), 9.25 (1H, br s).	融点 257 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C ₂₄ H ₂₇ N ₂ O ₃ Cl·1.2CH ₃ SO ₃ H·0.51H ₂ O 計算値 C, 61.00; H, 5.22; N, 4.56; Cl, 5.77; S, 6.01. 実測値 C, 60.83; H, 5.41; N, 4.20; Cl, 5.79; S, 6.17. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 3012, 1626, 1545, 1508, 1466, 1429, 1369, 1317, 1197, 1116, 1050, 948, 928, 901, 868, 822, 799, 785. Mass (FAB) 499 (M+H)⁺.
化合物 13 メタンスルホン酸塩 収率 79 (%)		NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.45 (1H, m), 0.51 (1H, m), 0.64 (1H, m), 0.74 (1H, m), 1.12 (1H, m), 1.85 (1H, d, J=12.2 Hz), 2.30 (3H, s), 2.60-2.80 (3H, m), 2.61 (3H, s), 2.95 (1H, m), 3.00 (1H, d, J=16.1 Hz), 3.13 (1H, m), 3.25-3.50 (3H, m), 4.09 (1H, d, J=5.9 Hz), 5.78 (1H, s), 6.37 (1H, s), 6.60 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.64 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.32 (1H, s), 7.47 (1H, t, J=7.3 Hz), 7.57 (1H, t, J=7.3 Hz), 7.97 (1H, d, J=8.3 Hz), 8.43 (1H, d, J=8.3 Hz), 8.94 (1H, br), 9.20 (1H, s), 12.15 (1H, s).	融点 270-280 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C ₂₄ H ₂₇ N ₂ O ₃ ·CH ₃ SO ₃ H·0.71H ₂ O 計算値 C, 65.44; H, 6.08; N, 4.77; S, 5.46. 実測値 C, 65.51; H, 6.28; N, 4.52; S, 5.13. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 3200, 1632, 1620, 1508, 1460, 1330, 1201, 1160, 1116, 1044, 859. Mass (FAB) 479 (M+H)⁺.

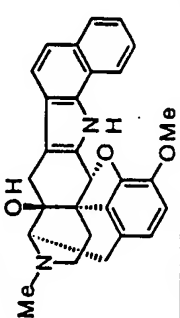
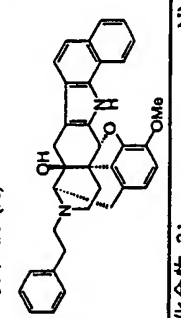
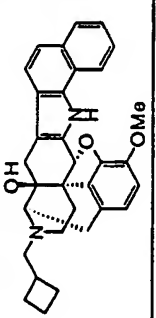
<p>化合物 14 メタンスルホン酸塩 収率 43 (%)</p>	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.45 (1H, m), 0.51 (1H, m), 0.64 (1H, m), 0.75 (1H, m), 1.12 (1H, m), 1.86 (1H, d, J=11.7 Hz), 2.30 (3H, s), 2.55-2.75 (3H, m), 2.95 (1H, m), 3.01 (1H, d, J=16.1 Hz), 3.13 (1H, m), 3.25-3.50 (3H, m), 4.09 (1H, d, J=6.4 Hz), 5.79 (1H, s), 6.40 (1H, s), 6.61 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.65 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.30 (1H, d, J=11.2 Hz), 7.53 (1H, t, J=7.3 Hz), 7.67 (1H, t, J=7.3 Hz), 8.02 (1H, d, J=8.3 Hz), 8.47 (1H, d, J=8.3 Hz), 8.95 (1H, br), 9.22 (1H, br), 12.38 (1H, s).</p> 	<p>融点 265-275 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₀H₂₇N₂O₃F·CH₃SO₃H·0.5H₂O·0.2AcOEt 計算値 C, 63.10; H, 5.60; N, 4.63; F, 3.14; S, 5.30. 実測値 C, 62.99; H, 5.89; N, 4.43; F, 3.13; S, 5.16. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 3200, 1638, 1510, 1460, 1381, 1330, 1205, 1156, 1116, 1046, 857. Mass (FAB) 483 (M+H)⁺.</p>
<p>化合物 15 メタンスルホン酸塩 収率 48 (%)</p>	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.40-0.51 (2H, m), 0.51-0.63 (1H, m), 0.63-0.72 (2H, m), 1.88 (1H, d, J=12 Hz), 2.60-2.82 (3H, m), 2.88-2.99 (1H, m), 3.04 (1H, d, J=16 Hz), 3.10-3.18 (1H, m), 3.21-3.31 (1H, m), 3.36-3.53 (4H, m), 4.07 (1H, d, J=6.8 Hz), 5.83 (1H, s), 6.39 (1H, br s), 6.61 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.65 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.36-7.44 (5H, m), 7.50 (2H, t, J=7.8 Hz), 7.58 (1H, t, J=7.8 Hz), 7.76 (1H, d, J=8.8 Hz), 8.52 (1H, d, J=7.8 Hz), 8.96 (1H, br s), 9.24 (1H, br s).</p> 	<p>融点 261 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₆H₃₂N₂O₃·1.25CH₃SO₃H·0.2H₂O 計算値 C, 67.04; H, 5.96; N, 4.20; S, 6.01. 実測値 C, 67.04; H, 5.85; N, 4.46; S, 5.75. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 1638, 1562, 1543, 1510, 1460, 1330, 1203, 1116, 1048, 901, 857, 777, 704, 634. Mass (FAB) 541 (M+H)⁺.</p>
<p>化合物 16 メタンスルホン酸塩 収率 74 (%)</p>	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.40-0.56 (2H, m), 0.57-0.68 (1H, m), 0.69-0.80 (1H, m), 1.02-1.15 (1H, m), 1.28 (9H, s), 1.84 (1H, d, J=12.2 Hz), 2.32 (3.6H, s), 2.51-2.77 (3H, m), 2.91-3.07 (2H, m), 3.08-3.19 (1H, m), 3.23-3.58 (4H, m), 3.67 (3H, s), 4.10 (1H, d, J=6.35 Hz), 5.73 (1H, s), 6.31 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.72 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.81 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.18-7.29 (3H, m), 8.97 (1H, br s), 11.19 (1.2H, s).</p> 	<p>融点 217-219 (°C). 元素分析値 組成式 C₃₁H₃₀N₂O₃·1.2CH₃SO₃H·0.5H₂O 計算値 C, 63.31; H, 6.92; N, 4.78; S, 6.32. 実測値 C, 63.31; H, 6.94; N, 4.78; S, 6.55. IR (cm⁻¹) (KBr) 2962, 1636, 1560, 1543, 1508, 1460, 1197, 1122, 1054, 895, 812, 561. Mass (FAB) 485 (M+H)⁺.</p>

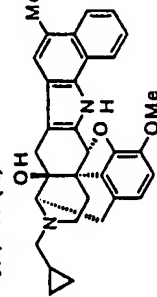
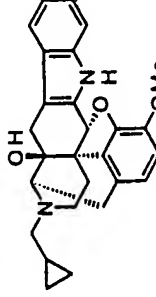
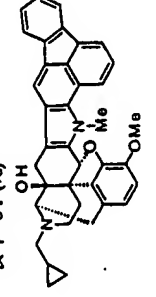
<p>化合物 17 塩酸塩 収率 81 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.47 (1H, m), 0.53 (1H, m), 0.66 (1H, m), 0.75 (1H, m), 1.14 (1H, m), 1.86 (1H, d, J=9.8 Hz), 2.61 (1H, d, J=16.1 Hz), 2.65-2.75 (2H, m), 3.00 (1H, m), 3.10 (1H, d, J=16.1 Hz), 3.15 (1H, m), 3.30-3.45 (2H, m), 3.51 (1H, d, J=20.0 Hz), 3.67 (3H, s), 4.18 (1H, d, J=5.9 Hz), 5.87 (1H, s), 6.52 (1H, s), 6.73 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.81 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.40-7.50 (3H, m), 7.54 (1H, t, J=7.3 Hz), 7.89 (1H, d, J=7.8 Hz), 8.44 (1H, d, J=8.3 Hz), 9.05 (1H, br), 12.34 (1H, s).</p>	<p>融点 245-255 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₁H₃₂N₂O₃·HCl·0.3H₂O 計算値 C, 71.54; H, 6.12; N, 5.38; Cl, 6.88. 実測値 C, 71.49; H, 6.29; N, 5.56; Cl, 6.57. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 3200, 1632, 1611, 1508, 1444, 1390, 1332, 1174, 1122, 1050, 893. Mass (FAB) 479 (M+H⁺).</p>
<p>化合物 18 リン酸塩 収率 77 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.25-0.35 (2H, m), 0.50-0.65 (2H, m), 0.99 (1H, m), 1.70 (1H, d, J=11.7 Hz), 2.36 (1H, m), 2.45 (1H, m), 2.56 (1H, d, J=16.1 Hz), 2.62 (1H, m), 2.75-2.95 (3H, m), 3.05 (1H, m), 3.32 (1H, m), 3.63 (1H, br), 5.73 (1H, s), 6.54 (1H, d, J=7.8 Hz), 6.72 (1H, d, J=7.8 Hz), 7.01 (1H, t, J=7.8 Hz), 7.40 (1H, t, J=8.3 Hz), 7.41 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.48 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.53 (1H, t, J=6.8), 7.88 (1H, d, J=8.3 Hz), 8.40 (1H, d, J=7.8 Hz), 12.13 (1H, s).</p>	<p>融点 265-280 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₀H₃₀N₂O₇·1.2H₃PO₄·0.6H₂O·0.2Et₂O 計算値 C, 62.51; H, 5.93; N, 4.73; P, 6.28. 実測値 C, 62.51; H, 6.95; N, 4.60; P, 6.30. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 3200, 1620, 1607, 1462, 1354, 1390, 1104. Mass (FAB) 449 (M+H⁺).</p>
<p>化合物 19 メタンスルホン酸塩 収率 88 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.42-0.58 (2H, m), 0.61-0.71 (1H, m), 0.71-0.81 (1H, m), 1.08-1.18 (1H, m), 1.88 (1H, d, J=11.2 Hz), 2.30 (3.75H, s), 2.61-2.82 (2H, m), 2.93-3.02 (1H, m), 3.12-3.21 (2H, m), 3.25-3.50 (3H, m), 3.50-3.56 (2H, m), 4.12 (1H, d, J=6.4 Hz), 5.83 (1H, s), 6.46 (1H, br s), 6.63 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.66 (1H, d, J=7.8 Hz), 7.31-7.41 (2H, m), 7.76 (1H, t, J=7.3 Hz), 7.97 (1H, d, J=7.3 Hz), 8.01 (1H, d, J=7.3 Hz), 8.06 (1H, d, J=7.3 Hz), 8.14 (1H, s), 8.38 (1H, d, J=8.3 Hz), 8.99 (1.25H, br s), 9.25 (1H, br s), 12.64 (1H, s).</p>	<p>融点 275 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₀H₃₀N₂O₃·1.25CH₃SO₃H·0.2Et₂O 計算値 C, 67.85; H, 5.54; N, 4.16; S, 5.95. 実測値 C, 67.65; H, 5.59; N, 4.39; S, 5.64. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 3058, 1620, 1562, 1508, 1437, 1398, 1330, 1180, 1116, 1048, 903, 864, 779. Mass (FAB) 539 (M+H⁺).</p>

<p>化合物 20 塩酸塩 収率 73 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.42 (1H, m), 0.52 (1H, m), 0.64 (1H, m), 0.73 (1H, m), 1.12 (1H, m), 1.84 (1H, d, J=11.7 Hz), 2.50-2.75 (3H, m), 2.90-3.15 (3H, m), 3.25-3.45 (3H, m), 3.96 (1H, d, J=22.5 Hz), 4.05 (1H, d, J=22.5 Hz), 4.13 (1H, d, J=5.9 Hz), 5.73 (1H, s), 6.45 (1H, s), 6.59 (1H, d, J=7.8 Hz), 6.67 (1H, d, J=7.8 Hz), 7.24 (1H, t, J=7.3 Hz), 7.34 (1H, t, J=7.8 Hz), 7.37 (1H, d, J=7.8 Hz), 7.54 (1H, d, J=7.8 Hz), 7.61 (1H, d, J=7.3 Hz), 7.80 (1H, d, J=7.8 Hz), 9.00 (1H, br), 9.29 (1H, s), 11.64 (1H, s).</p>	<p>融点 235-270 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₁H₃₃N₂O₃·HCl·0.7H₂O 計算値 C, 71.85; H, 5.92; N, 5.08; Cl, 6.43. 実測値 C, 71.83; H, 6.16; N, 5.09; Cl, 6.19. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 3200, 1620, 1508, 1460, 1431, 1332, 1158, 1114, 1038, 859. Mass (EI) 502 (M⁺). (塩フリー体のデータ)</p>
<p>化合物 21 メタンсульホン酸塩 収率 83 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.42-0.55 (m, 2H), 0.61-0.70 (m, 1H), 0.71-0.81 (m, 1H), 1.06-1.17 (m, 1H), 1.82-1.91 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.56-2.79 (m, 3H), 2.93-3.03 (m, 1H), 3.09-3.20 (m, 2H), 3.30-3.60 (m, 1H), 3.50 (s, 3H), 4.16 (d, J=6.3 Hz, 1H), 5.98 (d, J=18.1 Hz, 1H), 6.02 (s, 1H), 6.08 (d, J=18.1 Hz, 1H), 6.45 (br s, 1H), 6.76 (d, J=8.3 Hz, 1H), 6.82 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.02 (m, 2H), 7.18-7.28 (m, 3H), 7.30-7.37 (m, 2H), 7.52 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.55 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.88-7.94 (m, 1H), 8.13-8.19 (m, 1H), 9.01 (br s, 1H).</p>	<p>融点 280-290 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₁H₃₃N₂O₃·ClH₃SO₃H·1.1H₂O 計算値 C, 66.67; H, 5.79; N, 4.44; S, 5.10. 実測値 C, 66.49; H, 6.07; N, 4.56; S, 5.10. IR (cm⁻¹) (KBr) 3396, 1620, 1562, 1510, 1460, 1390, 1197, 1050. Mass (FAB) 515 (M+H⁺).</p>
<p>化合物 22 メタンсульホン酸塩 収率 60 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (300 MHz, DMSO-d₆) 0.43-0.57 (2H, m), 0.61-0.70 (1H, m), 0.70-0.79 (1H, m), 1.06-1.17 (1H, m), 1.18 (0.03H, t, J=7.1 Hz), 1.89 (1H, d, J=13.2 Hz), 1.99 (0.03H, s), 2.31 (3.3H, s), 2.57-2.83 (3H, m), 2.91-3.17 (4H, m), 3.24-3.34 (2H, m), 3.97-3.99 (2H, m), 4.11 (1H, d, J=6.0 Hz), 5.79 (1H, s), 6.42 (1H, br s), 6.61 (1H, d, J=8.2 Hz), 6.66 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.27-7.38 (3H, m), 7.45-7.50 (1H, m), 7.61 (1H, d, J=7.4 Hz), 8.51 (1H, d, J=7.4 Hz), 8.97 (1.1H, br s), 9.23 (1H, br s), 11.65 (1H, s).</p>	<p>融点 >290 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₁H₃₃N₂O₃·1.1ClH₃SO₃H·1.1H₂O·0.01EtOAc 計算値 C, 65.19; H, 5.88; N, 4.45; S, 5.61. 実測値 C, 65.09; H, 5.98; N, 4.62; S, 5.52. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 2928, 1620, 1562, 1510, 1462, 1162, 1116, 1046, 777. Mass (EI) 502 (M⁺). (塩フリー体のデータ)</p>

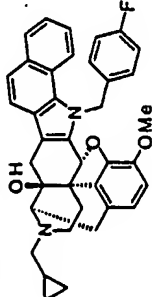
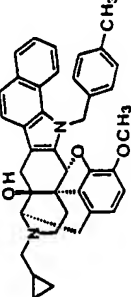
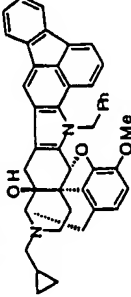
<p>化合物 23 メタンズルホン酸塩 収率 87 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (300 MHz, DMSO-d₆) 0.43-0.56 (2H, m), 0.62-0.83 (2H, m), 1.11 (1H, m), 1.88 (1H, d, J=11.8 Hz), 2.30 (3H, s), 2.60-2.73 (2H, m), 2.93-3.03 (2H, m), 3.13 (1H, m), 3.34-3.52 (4H, m), 4.19 (1H, d, J=4.1 Hz), 5.82 (1H, s), 6.42 (1H, br s), 6.61-6.67 (2H, m), 7.50 (1H, m), 7.54-7.61 (2H, m), 7.68 (1H, m), 8.21 (1H, d, J=7.4 Hz), 8.48 (1H, d, J=8.0 Hz), 8.78 (2H, d, J=8.0 Hz), 8.98 (1H, br s), 9.22 (1H, br s), 12.43 (1H, s).</p>	<p>融点 >250 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₁H₃₀N₂O₃·1.1CH₃SO₃H·0.6H₂O 計算値 C, 66.80; H, 5.69; N, 4.44; S, 5.59. 実測値 C, 66.64; H, 5.80; N, 4.69; S, 5.61. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 1638, 1200, 1048, 758, 559. Mass (FAB) 515 (M+H⁺).</p>
<p>化合物 24 塩酸塩 収率 44 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (500 MHz, DMSO-d₆) 0.45 (m, 1H), 0.52 (m, 1H), 0.63 (m, 1H), 0.73 (m, 1H), 1.12 (m, 1H), 1.83 (1H, m), 2.12 (m, 1H), 2.22 (m, 1H), 2.55 (d, 1H, J=16.2 Hz), 2.62-2.78 (m, 2H), 2.88 (m, 1H), 2.93-3.07 (m, 3H), 3.13 (m, 1H), 3.23-3.42 (m, 2H), 3.45 (d, 1H, J=18.5 Hz), 4.15 (d, 1H, J=5.8 Hz), 4.34-4.45 (m, 2H), 5.95 (s, 1H), 6.46 (s, 1H, OH), 6.60 (d, 1H, J=8.2 Hz), 6.66 (d, 1H, J=8.2 Hz), 7.03 (br t, 1H, J=7.6 Hz), 7.19 (br t, 1H, J=7.6 Hz), 7.38 (d, 1H, J=7.9 Hz), 7.58 (d, 1H, J=8.2 Hz), 8.19 (br s, 3H, NH₃⁺), 9.02 (br s, 1H, NH⁺), 9.23 (s, 1H, OH).</p>	<p>融点 >225 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₂₉H₃₃N₃O₃·1.95HCl·0.4H₂O 計算値 C, 63.34; H, 6.55; Cl, 12.57; N, 7.64. 実測値 C, 63.35; H, 6.66; Cl, 12.54; N, 7.50. IR (cm⁻¹) (KBr) 3380, 3210, 1626, 1506, 1466, 1379, 1328, 1296, 1210, 1191, 1156, 1116, 1056, 1031, 930, 855, 799, 748. Mass (FAB) 472 (M+H⁺).</p>
<p>化合物 25 塩酸塩 収率 73 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.47 (m, 1H), 0.52 (m, 1H), 0.64 (m, 1H), 0.74 (m, 1H), 1.13 (m, 1H), 1.87 (1H, m), 2.17-2.37 (m, 2H), 2.63 (d, 1H, J=16.1 Hz), 2.63-2.80 (m, 2H), 2.96-3.20 (m, 5H), 3.24-3.44 (m, 2H), 3.47 (d, 1H, J=19.5 Hz), 4.17 (d, 1H, J=5.4 Hz), 4.77-4.88 (m, 2H), 6.07 (s, 1H), 6.48 (s, 1H, OH), 6.62 (d, 1H, J=8.3 Hz), 6.67 (d, 1H, J=8.3 Hz), 7.46-7.56 (m, 3H), 7.63 (dd, 1H, J=7.8, 7.3 Hz), 7.98 (d, 1H, J=7.8 Hz), 8.19 (br s, 3H, NH₃⁺), 8.43 (d, 1H, J=7.8 Hz), 9.05 (br s, 1H, NH⁺), 9.24 (s, 1H, OH).</p>	<p>融点 >220 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₁H₃₃N₃O₃·1.95HCl·0.9H₂O 計算値 C, 65.09; H, 6.41; Cl, 11.35; N, 6.90. 実測値 C, 65.02; H, 6.51; Cl, 11.15; N, 7.02. IR (cm⁻¹) (KBr) 3376, 1620, 1506, 1462, 1425, 1392, 1328, 1309, 1270, 1247, 1189, 1160, 1116, 1048, 1031, 946, 903, 851, 806, 748. Mass (FAB) 522 (M+H⁺).</p>

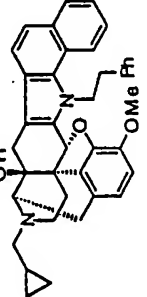
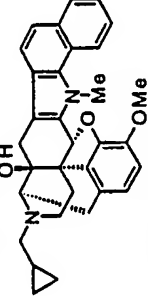
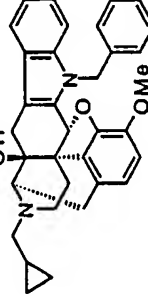
<p>化合物 26 メタンスルホン酸塩 収率 80 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.44 (m, 1H), 0.49 (m, 1H), 0.64 (m, 1H), 0.73 (m, 1H), 1.10 (m, 1H), 1.86 (br d, 1H, J=10.7 Hz), 2.29 (s, 3H), 2.56 (d, 1H, J=16.1 Hz), 2.62 (ddd, 1H, J=13.2, 4.4, 4.4 Hz), 2.73 (m, 1H), 2.95 (m, 1H), 2.99 (d, 1H, J=16.1 Hz), 3.06-3.18 (m, 3H), 3.27 (dd, 1H, J=20.0, 6.8 Hz), 3.39 (m, 1H), 3.44 (d, 1H, J=20.0 Hz), 4.09 (d, 1H, J=6.3 Hz), 4.59-4.73 (m, 2H), 6.03 (s, 1H), 6.33 (br s, 1H, OH), 6.61 (d, 1H, J=8.3 Hz), 6.64 (d, 1H, J=8.3 Hz), 7.05 (br t, 1H, J=7.3 Hz), 7.20 (br t, 1H, J=7.6 Hz), 7.38 (d, 1H, J=7.8 Hz), 7.62 (d, 1H, J=8.3 Hz), 8.94 (br s, 1H, NH⁺) 9.25 (br s, 1H, OH).</p>	<p>融点 285-295 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₂₈H₂₈N₂O₃·MeSO₃H 計算値 C, 63.93; H, 5.90; N, 7.45; S, 5.69. 実測値 C, 63.68; H, 5.92; N, 7.45; S, 5.62. IR (cm⁻¹) (KBr) 3528, 3030, 2254, 1649, 1618, 1506, 1470, 1437, 1377, 1330, 1193, 1152, 1114, 1038, 1011, 940, 868, 843, 801, 772. Mass (FAB) 468 ((M+H)⁺).</p>
<p>化合物 27 リン酸塩 収率 89 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.24-0.32 (2H, m), 0.54-0.65 (2H, m), 0.95-1.04 (1H, m), 1.73 (1H, d, J=11.7 Hz), 2.32-2.42 (1H, m), 2.43-2.51 (1H, m), 2.57-2.67 (1H, m), 2.64 (1H, d, J=15.6 Hz), 2.70-2.79 (1H, m), 2.84-2.91 (1H, m), 2.96-3.06 (1H, m), 3.03 (1H, d, J=15.6 Hz), 3.28 (1H, d, J=19.5 Hz), 3.62-3.66 (2H, m), 3.66 (3H, s), 5.77 (1H, s), 6.70 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.76 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.31-7.46 (2H, m), 7.76 (1H, dd, J=8.3, 7.3 Hz), 7.97 (1H, d, J=6.8 Hz), 8.01 (1H, d, J=6.8 Hz), 8.05 (1H, d, J=6.8 Hz), 8.16 (1H, s), 8.36 (1H, d, J=7.8 Hz), 12.64 (1H, s).</p>	<p>融点 282 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₂₇H₂₄N₂O₃·H₃PO₄·0.1Et₂O 計算値 C, 66.44; H, 5.67; N, 4.14; P, 4.58. 実測値 C, 66.37; H, 5.76; N, 4.33; P, 4.37. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 1611, 1562, 1508, 1439, 1398, 1284, 1255, 1154, 1122, 1050, 944, 897, 799, 723. Mass (FAB) 552 ((M+H)⁺).</p>
<p>化合物 28 メタンスルホン酸塩 収率 56 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (500 MHz, DMSO-d₆) 1.80-1.83 (m, 1H), 2.31 (s, 2.9H), 2.54 (d, J=16.1 Hz, 1H), 2.60 (dd, J=13.2, 4.9 Hz, 1H), 2.74 (dd, J=13.2, 3.4 Hz, 1H), 2.98 (d, J=16.1 Hz, 1H), 3.12 (dd, J=13.2, 4.9 Hz, 1H), 3.23 (d, J=19.0 Hz, 1H), 3.42 (d, J=19.0, 6.8 Hz, 1H), 3.67 (s, 3H), 3.86 (d, J=6.8 Hz, 1H), 5.81 (s, 1H), 6.11 (s, 1H), 6.75 (d, J=8.3 Hz, 1H), 6.80 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.41 (dd, J=6.8, 1.5 Hz, 1H), 7.43 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.47 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.54 (dd, J=6.8, 1.5 Hz, 1H), 7.89 (d, J=7.8 Hz, 1H), 8.41 (d, J=7.8 Hz, 1H), 8.58 (br s, 1H), 8.88 (br s, 1H), 12.2 (br s, 1H).</p>	<p>融点 260-266 (°C). 元素分析値 組成式 C₂₇H₂₄N₂O₃·0.9CH₃SO₃H·0.6Et₂O 計算値 C, 64.22; H, 5.56; N, 5.37; S, 5.53. 実測値 C, 64.22; H, 5.71; N, 5.36; S, 5.41. IR (cm⁻¹) (KBr) (塩ワリ一体のデータ) 3422, 1634, 1506, 1456, 1203, 1174, 1046, 893. Mass (FAB) 425 ((M+H)⁺).</p>

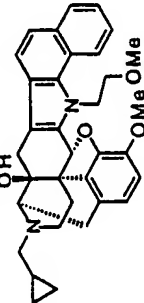
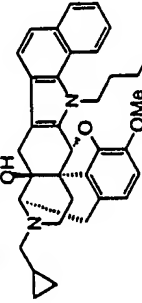
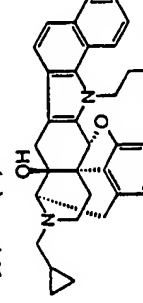
<p>化合物 29 メタンсульホン酸塩 収率 92 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (500 MHz, DMSO-d₆) 1.86 (dd, <i>J</i>=13.7, 2.4 Hz, 1H), 2.30 (s, 3.2 H), 2.59-2.66 (m, 2H), 2.73-2.75 (m, 1H), 2.91 (s, 3H), 2.98 (d, <i>J</i>=15.6 Hz, 1H), 3.12-3.19 (m, 1H), 3.28 (dd, <i>J</i>=20.4, 6.4 Hz, 1H), 3.53 (d, <i>J</i>=20.4 Hz, 1H), 3.68 (s, 3H), 3.52-3.87 (m, 1H), 5.85 (s, 1H), 6.37 (br s, 1H), 6.75 (d, <i>J</i>=8.3 Hz, 1H), 6.82 (d, <i>J</i>=8.3 Hz, 1H), 7.41 (td, <i>J</i>=6.8, 1.0 Hz, 1H), 7.43 (d, <i>J</i>=8.8 Hz, 1H), 7.49 (d, <i>J</i>=8.8 Hz, 1H), 7.55 (td, <i>J</i>=6.8, 1.0 Hz, 1H), 7.90 (d, <i>J</i>=8.3 Hz, 1H), 8.41 (d, <i>J</i>=8.3 Hz, 1H), 9.27 (br s, 1H), 12.3 (br s, 1H).</p>	<p>融点 260-263 (°C). 元素分析値 組成式 C₂₄H₂₆N₂O₃·Cl₂SO₃H·0.5H₂O 計算値 C, 64.07; H, 5.75; N, 5.15; S, 5.90. 実測値 C, 64.12; H, 6.03; N, 5.05; S, 5.77. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 1636, 1508, 1454, 1390, 1332, 1205, 1174, 1046, 812. Mass (FAB) 439 (M+H⁺).</p>
<p>化合物 30 収率 25 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (300 MHz, CDCl₃) 1.66-1.78 (m, 1H), 1.80-1.94 (m, 2H), 2.32-2.46 (m, 2H), 2.66 (d, <i>J</i>=15.9 Hz, 1H), 2.68-2.98 (m, 4H), 3.10-3.20 (m, 1H), 3.22 (d, <i>J</i>=18.6 Hz, 1H), 3.66-3.74 (m, 1H), 3.75 (s, 3H), 4.65 (br s, 1H), 5.77 (s, 1H), 6.62 (m, 2H), 7.18-7.52 (m, 9H), 7.85 (d, <i>J</i>=7.9 Hz, 1H), 7.93 (d, <i>J</i>=7.9 Hz, 1H), 8.95 (br s, 1H).</p>	<p>融点 (未測定) (°C). 元素分析値 組成式 (未測定) 計算値 実測値 IR (cm⁻¹) (未測定) Mass (EI) 528 (M⁺)</p>
<p>化合物 31 メタンсульホン酸塩 収率 50 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 1.82-2.27 (m, 7H), 2.29 (s, 3H), 2.57 (d, <i>J</i>=15.6 Hz, 1H), 2.62-2.69 (m, 1H), 2.70-2.81 (m, 2H), 3.02 (d, <i>J</i>=15.6 Hz, 1H), 3.05-3.18 (m, 2H), 3.23-3.30 (m, 1H), 3.43-3.54 (m, 2H), 3.62-3.68 (m, 1H), 3.67 (s, 3H), 5.84 (s, 1H), 6.33 (s, 1H), 6.75 (d, <i>J</i>=8.3 Hz, 1H), 6.83 (d, <i>J</i>=8.3 Hz, 1H), 7.38-7.48 (m, 3H), 7.52-7.57 (m, 1H), 7.89 (d, <i>J</i>=8.3 Hz, 1H), 8.41 (d, <i>J</i>=8.3 Hz, 1H), 8.91 (br s, 1H), 12.3 (s, 1H).</p>	<p>融点 231-247 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₂₂H₂₂N₂O₃·Cl₂SO₃H·0.2H₂O 計算値 C, 66.92; H, 6.19; N, 4.73; S, 5.41. 実測値 C, 66.84; H, 6.35; N, 4.77; S, 5.34. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 1638, 1508, 1454, 1390, 1332, 1205, 1122, 1048, 893. Mass (FAB) 493 (M+H⁺).</p>

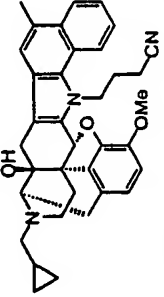
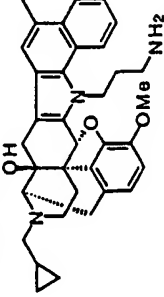
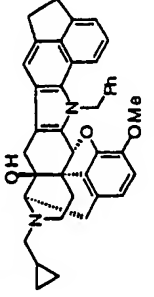
<p>化合物 32 メタンスルホン酸塩 収率 73 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.46 (1H, m), 0.51 (1H, m), 0.65 (1H, m), 0.75 (1H, m), 1.12 (1H, m), 1.87 (1H, d, J=11.7 Hz), 2.30 (3H, s), 2.60-2.75 (3H, m), 2.61 (3H, s), 2.96 (1H, m), 3.02 (1H, d, J=16.1 Hz), 3.15 (1H, m), 3.30-3.45 (2H, m), 3.51 (1H, d, J=20.0 Hz), 3.67 (3H, s), 4.11 (1H, d, J=6.4 Hz), 5.84 (1H, s), 6.42 (1H, br), 6.74 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.82 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.31 (1H, s), 7.47 (1H, t, J=7.3 Hz), 7.57 (1H, t, J=6.8 Hz), 7.97 (1H, d, J=8.3 Hz), 8.43 (1H, d, J=8.3 Hz), 8.98 (1H, br), 12.17 (1H, s).</p>	<p>融点 235-250 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₂H₃₂N₂O₃·CH₃SO₃H·0.6H₂O 計算値 C, 66.11; H, 6.25; N, 4.67; S, 5.35. 実測値 C, 65.15; H, 6.41; N, 4.72; S, 5.31. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 3200, 1655, 1636, 1610, 1508, 1444, 1332, 1284, 1200, 1168, 1122, 1052, 893. Mass (FAB) 493 (M+H⁺).</p>
<p>化合物 33 メタンスルホン酸塩 収率 47 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (500 MHz, DMSO-d₆) 0.45 (1H, m), 0.50 (1H, m), 0.64 (1H, m), 0.74 (1H, m), 1.10 (1H, m), 1.82 (1H, br d, J=13.4 Hz), 2.31 (3H, s), 2.54 (1H, d, J=15.9 Hz), 2.58-2.80 (2H, m), 2.91-3.2 (1H, m), 2.97 (1H, d, J=15.9 Hz), 3.12 (1H, m), 3.31 (1H, dd, J=20.1, 6.7 Hz), 3.39 (1H, m), 3.49 (1H, d, J=20.1 Hz), 3.68 (3H, s), 4.11 (1H, d, J=6.7 Hz), 5.75 (1H, s), 6.37 (1H, br s), 6.73 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.81 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.97 (1H, t, J=7.9 Hz), 7.11 (1H, dd, J=7.9, 7.3 Hz), 7.35 (2H, d, J=9.15 Hz), 8.95 (1H, br s), 11.34 (1H, s).</p>	<p>融点 >300 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₂₇H₂₄N₂O₃·1.05CH₃SO₃H·0.4H₂O 計算値 C, 62.78; H, 6.20; N, 5.22; S, 6.27. 実測値 C, 62.65; H, 6.19; N, 5.20; S, 6.42. IR (cm⁻¹) (KBr) 3252, 1636, 1510, 1456, 1328, 1191, 1122, 1044, 859, 797, 774. Mass (FAB) 429 (M+H⁺).</p>
<p>化合物 34 メタンスルホン酸塩 収率 64 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.44-0.56 (2H, m), 0.63-0.70 (1H, m), 0.74-0.80 (1H, m), 1.08-1.18 (1H, m), 1.94 (1H, d, J=12.2 Hz), 2.31 (3.75H, s), 2.64-2.81 (2H, m), 2.74 (1H, d, J=16.1 Hz), 2.97-3.04 (1H, m), 3.17 (1H, d, J=11.2 Hz), 3.22 (1H, d, J=16.1 Hz), 3.33-3.46 (2H, m), 3.51-3.59 (3H, m), 3.70 (3H, s), 4.16 (1H, d, J=6.4 Hz), 4.33 (3H, s), 6.14 (1H, s), 6.46 (1H, br s), 6.78 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.84 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.34-7.43 (2H, m), 7.82 (1H, dd, J=8.3, 7.3 Hz), 7.99 (1H, d, J=6.8 Hz), 8.03 (1H, d, J=7.3 Hz), 8.14 (1H, d, J=6.8 Hz), 8.19 (1H, s), 8.51 (1H, d, J=8.3 Hz), 9.04 (1.3H, br s).</p>	<p>融点 255-257 (°C). 元素分析値 組成式 C₂₈H₂₄N₂O₃·1.3CH₃SO₃H·0.3H₂O 計算値 C, 67.72; H, 5.76; N, 4.02; S, 5.98. 実測値 C, 67.64; H, 5.85; N, 4.14; S, 6.17. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 2914, 1738, 1636, 1502, 1452, 1396, 1261, 1118, 1050, 951, 893, 859, 797, 770, 611. Mass (FAB) 506 (M+H⁺).</p>

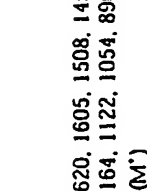
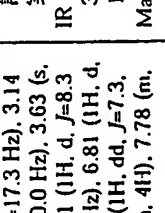
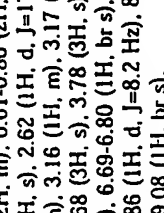
化合物 35 メタンズルホン酸塩 収率 81 (%) 	NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.46 (1H, m), 0.51 (1H, m), 0.65 (1H, m), 0.75 (1H, m), 1.11 (1H, m), 1.87 (1H, d, J=12.2 Hz), 2.34 (3H, s), 2.50-2.75 (3H, m), 2.96 (1H, m), 3.02 (1H, d, J=16.1 Hz), 3.14 (1H, m), 3.30 (1H, m), 3.51 (1H, d, J=20.0 Hz), 3.69 (3H, s), 3.96 (1H, d, J=22.5 Hz), 4.06 (1H, d, J=22.5 Hz), 4.12 (1H, d, J=6.8 Hz), 5.79 (1H, s), 6.42 (1H, brs), 6.74 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.83 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.24 (1H, t, J=7.8 Hz), 7.35 (1H, t, J=7.8 Hz), 7.37 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.55 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.61 (1H, d, J=7.3 Hz), 7.81 (1H, d, J=7.3 Hz), 8.98 (1H, br), 11.64 (1H, s).	融点 250-260 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C ₃₄ H ₃₂ N ₂ O ₃ ·Cl _{1.5} SO ₃ H·0.6H ₂ O 計算値 C, 67.42; H, 6.01; N, 4.49; S, 5.14. 実測値 C, 67.29; H, 6.17; N, 4.60; S, 5.28. IR (cm ⁻¹) (KBr) 3350, 1636, 1508, 1433, 1334, 1195, 1122, 1052, 973, 891. Mass (EI) 516 (M ⁺). (塩フリー体のデータ)
化合物 36 収率 87 (%) 	NMR (ppm) (400 MHz, CDCl₃) 0.14-0.22 (m, 2H), 0.54-0.64 (m, 2H), 0.93 (m, 1H), 1.84 (m, 1H), 2.32 (ddd, 1H, J=11.7, 11.7, 3.4 Hz), 2.42-2.51 (m, 3H), 2.69 (d, 1H, J=15.6 Hz), 2.77 (dd, 1H, J=11.7, 4.4 Hz), 2.85 (dd, 1H, J=18.1, 6.4 Hz), 2.95 (d, 1H, J=15.6 Hz), 3.17 (d, 1H, J=18.1 Hz), 3.25-3.45 (m, 5H), 3.74 (s, 3H), 5.00 (br s, 1H, OH), 5.78 (s, 1H), 6.60 (d, 1H, J=8.1 Hz), 6.63 (d, 1H, J=8.1 Hz), 7.20 (s, 1H), 7.21 (d, 1H, J=7.8 Hz), 7.42 (dd, 1H, J=7.8, 7.8 Hz), 7.62 (d, 1H, J=7.8 Hz), 8.88 (s, 1H, NH).	融点 (未測定) (°C). 元素分析値 組成式 (未測定) 計算値 実測値 IR (cm ⁻¹) (KBr) 3260, 1632, 1605, 1506, 1439, 1406, 1388, 1332, 1284, 1195, 1147, 1123, 1054, 1021, 888, 864, 791, 756. Mass (EI) 504 (M ⁺)
化合物 37 メタンズルホン酸塩 収率 73 (%) 	NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.42-0.55 (m, 2H), 0.61-0.70 (m, 1H), 0.71-0.81 (m, 1H), 1.06-1.17 (m, 1H), 1.82-1.91 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.56-2.79 (m, 3H), 2.93-3.03 (m, 1H), 3.09-3.20 (m, 2H), 3.30-3.60 (m, 3H), 3.50 (s, 3H), 4.16 (d, J=6.3 Hz, 1H), 5.98 (d, J=18.1 Hz, 1H), 6.02 (s, 1H), 6.08 (d, J=18.1 Hz, 1H), 6.45 (br s, 1H), 6.76 (d, J=8.3 Hz, 1H), 6.82 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.02 (m, 2H), 7.18-7.28 (m, 3H), 7.30-7.37 (m, 2H), 7.52 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.55 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.88-7.94 (m, 1H), 8.13-8.19 (m, 1H), 9.01 (br s, 1H).	融点 190-197 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C ₃₄ H ₃₂ N ₂ O ₃ ·1.15CH ₃ SO ₃ H·0.8H ₂ O 計算値 C, 67.79; H, 6.13; N, 4.04; S, 5.32. 実測値 C, 67.67; H, 6.24; N, 4.17; S, 5.42. IR (cm ⁻¹) (KBr) 3382, 1499, 1452, 1396, 1284, 1158, 1125, 1056, 893. Mass (FAB) 569 (M+H ⁺).

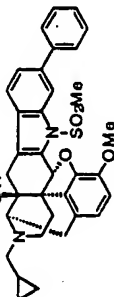
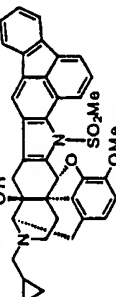
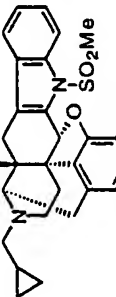
<p>化合物 38 メタンズルホン酸塩 収率 57 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (300 MHz, DMSO-d₆) 0.53-0.66 (2H, m), 0.62-0.80 (2H, m), 1.12 (1H, m), 1.86 (1H, d, J=11.3 Hz), 2.30 (3H, s), 2.55-2.77 (3H, m), 2.99 (1H, m), 3.11-3.19 (2H, m), 3.31-3.45 (3H, m), 3.51 (3H, s), 4.16 (1H, d, J=6.0 Hz), 6.02 (1H, s), 6.04 (2H, d, J=14.0 Hz), 6.46 (1H, s, OH), 6.75-6.84 (2H, m), 6.99-7.11 (4H, m), 7.34 (1H, d, J=3.3 Hz), 7.36 (1H, d, J=3.3 Hz), 7.51-7.58 (2H, m), 7.91 (1H, m), 8.15 (1H, m), 9.01 (1H, s).</p>	<p>融点 >200 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₈H₃₅FN₂O₃·CH₃SO₃H·1.2H₂O 計算値 C, 66.50; H, 5.92; F, 2.70; N, 3.98; S, 4.55. 実測値 C, 66.27; H, 5.91; F, 2.77; N, 3.91; S, 4.90. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 1636, 1607, 1510, 1439, 1396, 1201, 1123, 1044, 851, 810. Mass (FAB) 587 (M+H)⁺.</p>
<p>化合物 39 メタンズルホン酸塩 収率 78 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (300 MHz, DMSO-d₆) 0.42-0.56 (2H, m), 0.62-0.80 (2H, m), 1.12 (1H, m), 1.86 (1H, d, J=11.3 Hz), 2.23 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.54-2.77 (3H, m), 2.98 (1H, m), 3.09-3.21 (2H, m), 3.31-3.57 (6H, m), 4.16 (1H, d, J=5.8 Hz), 5.93 (1H, d, J=17.9 Hz), 6.00 (1H, s), 6.03 (1H, d, J=17.9 Hz), 6.44 (1H, br s), 6.76 (1H, d, J=8.2 Hz), 6.82 (1H, d, J=8.2 Hz), 6.91 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.05 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.32-7.35 (2H, m), 7.52 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.56 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.89-7.92 (1H, m), 8.15-8.19 (1H, m), 9.02 (1H, br s).</p>	<p>融点 196-200 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₉H₃₇N₂O₃·1.05CH₃SO₃H·1.31H₂O 計算値 C, 68.03; H, 6.39; N, 3.96; S, 4.76. 実測値 C, 67.93; H, 6.31; N, 4.25; S, 4.89. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 1508, 1454, 1439, 1396, 1197, 1123, 1052, 804, 561. Mass (FAB) 583 (M+H)⁺.</p>
<p>化合物 40 メタンズルホン酸塩 収率 76 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.46-0.56 (2H, m), 0.65-0.73 (1H, m), 0.73-0.82 (1H, m), 1.11-1.19 (1H, m), 1.89 (1H, d, J=12.7 Hz), 2.30 (3.75H, s), 2.59-2.81 (2H, m), 2.85 (1H, d, J=16.1 Hz), 2.96-3.06 (1H, m), 3.13-3.19 (1H, m), 3.31 (1H, d, J=16.1 Hz), 3.31-3.48 (2H, m), 3.53 (3H, s), 3.55-3.63 (1H, m), 4.18 (1H, d, J=6.3 Hz), 5.99 (1H, d, J=18.1 Hz), 6.07 (1H, s), 6.12 (1H, d, J=18.1 Hz), 6.52 (1H, br s), 6.77 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.84 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.07 (2H, d, J=7.3 Hz), 7.19-7.29 (1H, m), 7.25 (2H, d, J=7.3 Hz), 7.31-7.42 (2H, m), 7.57 (1H, dd, J=8.3, 7.3 Hz), 8.00 (2H, d, J=7.3 Hz), 8.02 (2H, d, J=7.3 Hz), 8.04 (1H, d, J=7.3 Hz), 8.25 (1H, s), 9.05 (1.25H, br s).</p>	<p>融点 208-210 (°C). 元素分析値 組成式 C₄₁H₃₉N₂O₃·1.25CH₃SO₃H·1.11H₂O 計算値 C, 69.43; H, 5.82; N, 3.58; S, 5.12. 実測値 C, 69.51; H, 5.86; N, 3.38; S, 5.05. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 2928, 1736, 1719, 1702, 1686, 1649, 1636, 1562, 1543, 1510, 1454, 1396, 1340, 1284, 1149, 1125, 1056, 893, 774, 754. Mass (FAB) 643 (M+H)⁺.</p>

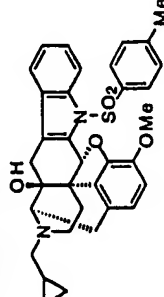
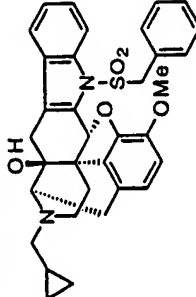
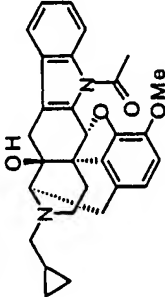
<p>化合物 41 メタンスルホン酸塩 収率 100 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (500 MHz, DMSO-d₆) 0.42-0.49 (m, 1H), 0.49-0.56 (m, 1H), 0.62-0.69 (m, 1H), 0.72-0.81 (m, 1H), 1.06-1.16 (m, 1H), 1.81-1.88 (m, 1H), 2.34 (s, 5.4H), 2.50-2.61 (m, 1H), 2.65 (d, J=16.1 Hz, 1H), 2.67-2.76 (m, 1H), 2.94-3.02 (m, 1H), 3.12 (d, J=16.1 Hz, 1H), 3.10-3.26 (m, 3H), 3.29-3.45 (m, 2H), 3.51 (d, J=20.0 Hz, 1H), 3.68 (s, 3H), 4.13 (d, J=6.3 Hz, 1H), 4.87-4.98 (m, 2H), 5.81 (s, 1H), 6.34 (br s, 1H), 6.76 (d, J=8.3 Hz, 1H), 6.84 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.30-7.36 (m, 1H), 7.40-7.58 (m, 7H), 7.68-7.74 (m, 1H), 8.01 (d, J=7.8 Hz, 1H), 8.55 (d, J=7.8 Hz, 1H), 8.99 (br s, 1H).</p>	<p>融点 130-137 (°C). 元素分析値 組成式 C₃₀H₃₅N₂O₃·2.0ClH₃SO₃H 計算値 C, 63.55; H, 5.98; N, 3.61; S, 8.28. 実測値 C, 63.33; H, 6.22; N, 3.82; S, 8.35. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 1607, 1506, 1441, 1394, 1284, 1193, 1156, 1123, 1054, 1021, 893. Mass (EI) 582 (M⁺). (塩フリー一体のデータ)</p>
<p>化合物 42 メタンスルホン酸塩 収率 100 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (300 MHz, DMSO-d₆) 0.40-0.57 (m, 2H), 0.59-0.68 (m, 1H), 0.68-0.80 (m, 1H), 1.04-1.18 (m, 1H), 1.85-1.95 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 2.60-2.81 (m, 2H), 2.64 (d, J=15.7 Hz, 1H), 2.90-3.02 (m, 1H), 3.09 (d, J=15.7 Hz, 1H), 3.11-3.20 (m, 1H), 3.26-3.50 (m, 2H), 3.52 (d, J=20.0 Hz, 1H), 3.69 (s, 1H), 4.10-4.16 (m, 1H), 4.32 (s, 1H), 6.10 (s, 1H), 6.39 (s, 1H), 6.74 (d, J=8.5 Hz, 1H), 6.82 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.43-7.52 (m, 3H), 7.55-7.63 (m, 1H), 7.97 (d, J=6.9 Hz, 1H), 8.62 (d, J=8.5 Hz, 1H), 9.00 (br s, 1H).</p>	<p>融点 300-305 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₂₇H₃₂N₂O₃·ClH₃SO₃H·0.5H₂O 計算値 C, 66.31; H, 6.24; N, 4.69; S, 5.36. 実測値 C, 66.47; H, 6.29; N, 4.58; S, 5.22. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 1499, 1437, 1398, 1257, 1019. Mass (EI) 492 (M⁺). (塩フリー一体のデータ)</p>
<p>化合物 43 メタンスルホン酸塩 収率 96 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.42-0.54 (2H, m), 0.61-0.79 (2H, m), 1.11 (1H, m), 1.87 (1H, d, J=11.7 Hz), 2.29 (3H, s), 2.57-2.77 (2H, m), 2.62 (1H, d, J=16.1 Hz), 2.98 (1H, m), 3.04 (1H, d, J=16.1 Hz), 3.14 (1H, m), 3.31-3.43 (2H, m), 3.51 (1H, m), 3.65 (3H, s), 4.13 (1H, d, J=6.4 Hz), 5.40 (1H, d, J=16.6 Hz), 5.65 (1H, d, J=16.6 Hz), 5.96 (1H, s), 6.40 (1H, s), 6.77 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.85 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.00 (1H, m), 7.09 (1H, m), 7.22-7.31 (6H, m), 7.40 (1H, d, J=7.8 Hz), 8.98 (1H, br s).</p>	<p>融点 171-176 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₁H₃₅N₂O₃·ClH₃SO₃H·1.2H₂O 計算値 C, 66.06; H, 6.40; N, 4.40; S, 5.04. 実測値 C, 66.03; H, 6.41; N, 4.43; S, 5.12. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 1510, 1452, 1197, 1052, 779, 741. Mass (FAB) 519 (M+H⁺).</p>

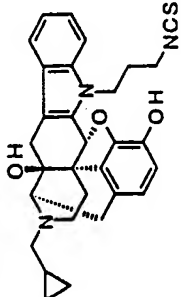
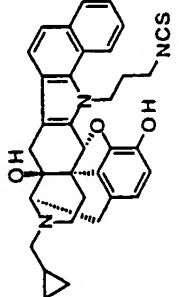
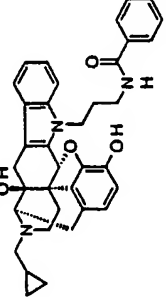
<p>化合物 44 塩酸塩 収率 117 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (500 MHz, DMSO-d₆) 0.42-0.49 (m, 1H), 0.49-0.56 (m, 1H), 0.60-0.69 (m, 1H), 0.71-0.79 (m, 1H), 1.09-1.18 (m, 1H), 1.86-1.93 (m, 1H), 2.59-2.77 (m, 2H), 2.62 (d, J=15.6 Hz, 1H), 2.96-3.04 (m, 1H), 3.10-3.18 (m, 1H), 3.14 (d, J=15.6 Hz, 1H), 3.30-3.44 (m, 2H), 3.32 (s, 3H), 3.51 (d, J=20.0 Hz, 1H), 3.70 (s, 3H), 3.81-3.95 (m, 2H), 4.18 (d, J=6.4 Hz, 1H), 4.86-4.99 (m, 2H), 6.10 (s, 1H), 6.46 (s, 1H), 6.75 (d, J=8.3 Hz, 1H), 6.83 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.43-7.55 (m, 3H), 7.57-7.63 (m, 1H), 7.98 (d, J=7.8 Hz, 1H), 8.43 (d, J=7.8 Hz, 1H), 9.05 (br s, 1H).</p>	<p>融点 185-190 (°C). 元素分析値 組成式 C₃₁H₃₅N₂O₄·1.17HCl·0.2H₂O 計算値 C, 70.06; H, 6.50; N, 4.81; Cl, 7.12. 実測値 C, 69.83; H, 6.63; N, 5.02; Cl, 6.96. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 1609, 1506, 1439, 1394, 1284, 1195, 1160, 1123, 1054, 1021, 893. Mass (EI) 536 (M⁺). (塩フリー体のデータ)</p>
<p>化合物 45 メタンсульホン酸塩 収率 47 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (300 MHz, DMSO-d₆) 0.41-0.58 (m, 2H), 0.60-0.70 (m, 1H), 0.70-0.81 (m, 1H), 1.50-1.21 (m, 1H), 1.73-2.07 (m, 5H), 2.30 (s, 3.6H), 2.53-2.81 (m, 5H), 2.91-3.05 (m, 1H), 3.10 (d, J=16.5 Hz, 1H), 3.12-3.22 (m, 1H), 3.25-3.57 (m, 3H), 3.69 (s, 3H), 4.13 (d, J=6.1 Hz, 1H), 4.65-4.85 (m, 2H), 6.08 (s, 1H), 6.40 (br s, 1H), 6.75 (d, J=8.5 Hz, 1H), 6.83 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.43-7.55 (m, 3H), 7.57-7.67 (m, 1H), 7.97 (d, J=8.2 Hz, 1H), 8.39 (d, J=8.2 Hz, 1H), 9.00 (br s, 1H).</p>	<p>融点 169-179 (°C). 元素分析値 組成式 C₃₅H₃₇N₃O₃·1.2Cl₃SO₃H·0.2H₂O 計算値 C, 65.84; H, 6.27; N, 6.19; S, 5.67. 実測値 C, 66.02; H, 6.47; N, 6.25; S, 5.39. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 2926, 2250, 1636, 1609, 1506, 1452, 1364, 1282, 1125, 1054, 1023, 891, 851. Mass (EI) 559 (M⁺). (塩フリー体のデータ)</p>
<p>化合物 46 メタンсульホン酸塩 収率 50 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (300 MHz, DMSO-d₆) 0.40-0.58 (m, 2H), 0.59-0.70 (m, 1H), 0.70-0.83 (m, 1H), 1.03-1.20 (m, 1H), 1.84-1.99 (m, 1H), 2.10-2.29 (m, 2H), 2.30 (s, 3.6H), 2.64 (d, J=16.4 Hz, 1H), 2.65-2.91 (m, 4H), 2.91-3.03 (m, 1H), 3.08 (d, J=16.4 Hz, 1H), 3.11-3.23 (m, 1H), 3.26-3.50 (m, 3H), 3.69 (s, 3H), 4.14 (d, J=5.5 Hz, 1H), 4.66-4.90 (m, 2H), 6.11 (s, 1H), 6.41 (br s, 1H), 6.76 (d, J=8.0 Hz, 1H), 6.84 (d, J=8.0 Hz, 1H), 7.40-7.68 (m, 4H), 7.99 (d, J=7.7 Hz, 1H), 8.42 (d, J=8.8 Hz, 1H), 8.90 (br s, 1H).</p>	<p>融点 175-182 (°C). 元素分析値 組成式 C₃₅H₃₅N₃O₃·1.2CH₃SO₃H·0.3H₂O 計算値 C, 65.24; H, 6.11; N, 6.31; S, 5.77. 実測値 C, 65.31; H, 6.29; N, 6.36; S, 5.60. IR (cm⁻¹) (KBr) (塩フリー体のデータ) 3388, 2932, 2246, 1636, 1611, 506, 1452, 1392, 1282, 1160, 1125, 1054, 1021, 893. Mass (EI) 545 (M⁺). (塩フリー体のデータ)</p>

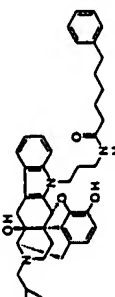
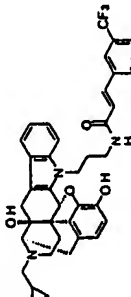
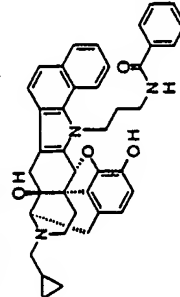
化合物 47 メタンスルホン酸塩 収率 99 (%)		NMR (ppm) (300 MHz, DMSO-d ₆) 0.40-0.58 (m, 2H), 0.59-0.70 (m, 1H), 0.70-0.80 (m, 1H), 1.04-1.18 (m, 1H), 1.86-1.95 (m, 1H), 2.11-2.25 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.62 (s, 3H), 2.57-2.92 (m, 5H), 2.93-3.23 (m, 3H), 3.24-3.58 (m, 3H), 3.69 (s, 3H), 4.08-4.16 (m, 1H), 4.66-4.87 (m, 2H), 6.09 (s, 1H), 6.37 (br s, 1H), 6.75 (d, J=8.2 Hz, 1H), 6.84 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.36 (s, 1H), 7.50-7.58 (m, 1H), 7.60-7.68 (m, 1H), 8.06 (d, J=7.1 Hz, 1H), 8.44 (d, J=7.1 Hz, 1H), 9.00 (br s, 1H).	融点 175 (°C). 元素分析値 組成式 C ₃₃ H ₃₇ NaO ₃ ·1.4CH ₃ SO ₃ H·0.11H ₂ O 計算値 C, 64.54; H, 6.20; N, 6.04; S, 6.45. 実測値 C, 64.58; H, 6.27; N, 6.04; S, 6.32. IR (cm ⁻¹) (KBr) 3404, 2250, 1760, 1638, 1599, 1508, 1491, 1452, 1203, 1122, 1089. Mass (EI) 559 (M ⁺). (塩フリー体のデータ)
化合物 48 メタンスルホン酸塩 収率 96 (%)		NMR (ppm) (300 MHz, CD ₃ OD) 0.40-0.46 (m, 2H), 0.58-0.75 (m, 2H), 0.96-1.08 (m, 1H), 1.84-1.92 (m, 1H), 2.32 (q, J=7.1 Hz, 2H), 2.52-2.60 (m, 2H), 2.64 (s, 3H), 2.68 (s, 3H), 2.64-2.74 (m, 2H), 2.70-3.24 (m, 6H), 3.31-3.40 (m, 1H), 3.77 (s, 3H), 4.72-5.02 (m, 2H), 5.95 (s, 1H), 6.75 (d, J=8.5 Hz, 1H), 6.82 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.40 (s, 1H), 8.06 (d, J=8.2 Hz, 1H), 8.43 (d, J=8.2 Hz, 1H).	融点 200 (°C). 元素分析値 組成式 C ₃₃ H ₃₉ NaO ₃ ·1.45CH ₃ SO ₃ H·0.6EtOAc 計算値 C, 62.89; H, 6.74; N, 5.66; S, 6.27. 実測値 C, 62.71; H, 6.56; N, 6.01; S, 6.08. IR (cm ⁻¹) (KBr) 3410, 1655, 1636, 1508, 1450, 1386, 1207, 1052. Mass (EI) 549 (M ⁺). (塩フリー体のデータ)
化合物 49 収率 99 (%)		NMR (ppm) (400 MHz, CDCl ₃) 0.17 (m, 2H), 0.58 (m, 2H), 0.91 (m, 1H), 1.77 (m, 1H), 2.29 (m, 1H), 2.37 (m, 1H), 2.41-2.48 (m, 2H), 2.73 (m, 1H), 2.79 (d, 1H, J=15.4 Hz), 2.86 (dd, 1H, J=18.6, 6.4 Hz), 3.00 (d, 1H, J=15.4 Hz), 3.17 (d, 1H, J=18.6 Hz), 3.30-3.40 (m, 5H), 3.62 (s, 3H), 4.93 (br s, 1H, OH), 5.74 (s, 1H), 5.95 (d, 1H, J=17.3 Hz), 6.03 (d, 1H, J=17.3 Hz), 6.59 (d, 1H, J=8.3 Hz), 6.62 (d, 1H, J=8.3 Hz), 7.06 (d, 2H, J=7.3 Hz), 7.13 (d, 1H, J=6.8 Hz), 7.17-7.27 (m, 4H), 7.37 (s, 1H), 7.63 (d, 1H, J=8.3 Hz).	融点 (未測定) (°C). 元素分析値 組成式 (未測定) 計算値 実測値 IR (cm ⁻¹) (KBr) 3376, 1605, 1499, 1450, 1412, 1336, 1284, 1259, 1193, 1164, 1122, 1054, 1019, 971, 917, 890, 864, 791, 748. Mass (EI) 594 (M ⁺)

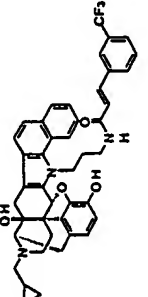
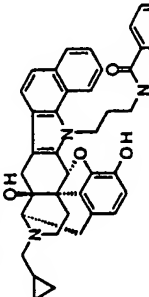
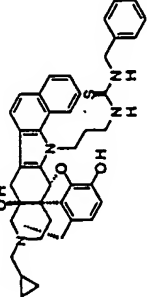
<p>化合物 50</p> <p>メタンスルホン酸塩</p> <p>収率 87 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, CDCl₃)</p> <p>0.18 (m, 2H), 0.58 (m, 2H), 0.92 (m, 1H), 1.86 (m, 1H), 2.32 (m, 1H), 2.39-2.52 (m, 3H), 2.72 (d, 1H, <i>J</i>=15.1 Hz), 2.75 (m, 1H), 2.84 (dd, 1H, <i>J</i>=18.6, 6.4 Hz), 3.16 (d, 1H, <i>J</i>=18.6 Hz), 3.25-3.44 (m, 5H), 3.76 (s, 3H), 4.32 (s, 3H), 4.95 (br s, 1H, OH), 5.85 (s, 1H), 6.59 (d, 1H, <i>J</i>=8.3 Hz), 6.63 (d, 1H, <i>J</i>=8.3 Hz), 7.22 (d, 1H, <i>J</i>=6.8 Hz), 7.25 (s, 1H), 7.44 (d, 1H, <i>J</i>=8.3, 6.8 Hz), 8.10 (d, 1H, <i>J</i>=8.3 Hz).</p>	<p>融点 (未測定) (°C).</p> <p>元素分析値 (未測定)</p> <p>計算値</p> <p>実測値</p> <p>IR (cm⁻¹) (KBr)</p> <p>3378, 1632, 1620, 1605, 1508, 1450, 1404, 1379, 1284, 1265, 1193, 1164, 1122, 1054, 890, 789, 750.</p> <p>Mass (EI) 518 (M⁺)</p>
<p>化合物 51</p> <p>メタンスルホン酸塩</p> <p>収率 54 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆)</p> <p>0.48 (m, 1H), 0.51 (m, 1H), 0.66 (m, 1H), 0.76 (m, 1H), 1.12 (m, 1H), 1.82 (m, 1H), 2.30 (s, 3H), 2.56-2.78 (m, 2H), 2.63 (d, 1H, <i>J</i>=17.3 Hz), 2.99 (m, 1H), 3.08 (d, 1H, <i>J</i>=17.3 Hz), 3.14 (m, 1H), 3.27-3.44 (m, 2H), 3.52 (d, 1H, <i>J</i>=20.0 Hz), 3.63 (s, 3H), 4.17 (d, 1H, <i>J</i>=6.4 Hz), 6.09 (s, 1H), 6.61 (1H, d, <i>J</i>=8.3 Hz), 6.65 (br s, 1H, OH), 6.75 (1H, d, <i>J</i>=8.3 Hz), 6.81 (1H, d, <i>J</i>=8.3 Hz), 7.11 (1H, dd, <i>J</i>=8.3, 7.3 Hz), 7.18 (1H, dd, <i>J</i>=7.3, 7.3 Hz), 7.47 (1H, d, <i>J</i>=7.8 Hz), 7.58-7.69 (m, 4H), 7.78 (m, 1H), 9.04 (m, 1H, NH⁺).</p>	<p>融点 >180 (dec) (°C).</p> <p>元素分析値</p> <p>組成式 C₃₄H₃₂N₂O₄·CH₃SO₃H·0.6H₂O</p> <p>計算値 C, 65.55; H, 5.88; N, 4.37; S, 5.00.</p> <p>実測値 C, 65.50; H, 5.87; N, 4.40; S, 5.30.</p> <p>IR (cm⁻¹) (KBr)</p> <p>3418, 1686, 1638, 1607, 1508, 1456, 1412, 1357, 1292, 1203, 1176, 1123, 1042, 932, 891, 748.</p> <p>Mass (FAB) 533 ((M+H)⁺).</p>
<p>化合物 52</p> <p>メタンスルホン酸塩</p> <p>収率 40 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (300 MHz, DMSO-d₆)</p> <p>0.42-0.57 (2H, m), 0.61-0.80 (2H, m), 1.12 (1H, m), 1.89 (1H, m), 2.30 (3H, s), 2.62 (1H, d, <i>J</i>=17.0 Hz), 2.62-2.77 (2H, m), 3.00 (1H, m), 3.16 (1H, m), 3.17 (1H, d, <i>J</i>=17.0 Hz), 3.27-3.58 (3H, m), 3.68 (3H, s), 3.78 (3H, s), 4.17 (1H, d, <i>J</i>=5.8 Hz), 6.29 (1H, s), 6.69-6.80 (1H, br s), 6.78 (2H, m), 7.52-7.65 (3H, m), 7.86 (1H, d, <i>J</i>=8.2 Hz), 8.04 (1H, m), 8.73 (1H, d, <i>J</i>=8.8 Hz), 9.08 (1H, br s).</p>	<p>融点 >190 (dec) (°C).</p> <p>元素分析値</p> <p>組成式 C₃₂H₃₂N₂O₅S·1.05CH₃SO₃H·H₂O</p> <p>計算値 C, 58.76; H, 5.70; N, 4.15; S, 9.73.</p> <p>実測値 C, 58.48; H, 5.66; N, 4.21; S, 10.02.</p> <p>IR (cm⁻¹) (KBr)</p> <p>3400, 1638, 1510, 1456, 1365, 1207, 1174, 1050, 553.</p> <p>Mass (FAB) 557 ((M+H)⁺).</p>

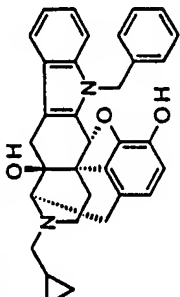
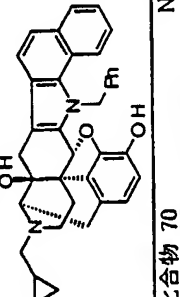
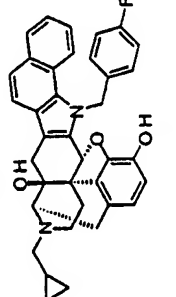
<p>化合物 53 メタンスルホン酸塩 収率 61 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.46 (1H, m), 0.52 (1H, m), 0.65 (1H, m), 0.75 (1H, m), 1.10 (1H, m), 1.91 (1H, m), 2.30 (2.85H, s), 2.50-2.75 (3H, m), 2.95-3.20 (3H, m), 3.30-3.55 (3H, m), 3.65 (3H, s), 3.69 (3H, s), 4.17 (1H, m), 6.11 (1H, s), 6.67 (1H, s), 6.78 (1H, d, J=7.8 Hz), 6.87 (1H, d, J=7.8 Hz), 7.39 (1H, t, J=7.3 Hz), 7.50 (2H, t, J=7.3 Hz), 7.56 (1H, d, J=7.3 Hz), 7.61 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.68 (2H, d, J=7.3 Hz), 8.18 (1H, s), 9.05 (0.95H, br).</p>	<p>融点 200-210 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₄H₃₄N₂O₅S · 0.95CH₃SO₃H · 0.2Et₂O 計算値 C, 62.34; H, 5.82; N, 4.07; S, 9.08. 実測値 C, 62.33; H, 5.63; N, 4.27; S, 8.90. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 1638, 1508, 1458, 1421, 1367, 1270, 1166, 1123, 1054, 984, 888. Mass (EI) 582 (M⁺). (塩フリー体のデータ)</p>
<p>化合物 54 メタンスルホン酸塩 収率 66 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.45-0.56 (2H, m), 0.64-0.71 (1H, m), 0.78-0.81 (1H, m), 1.11-1.19 (1H, m), 1.93 (1H, d, J=10.8 Hz), 2.31 (3.6H, s), 2.67-2.77 (3H, m), 3.00-3.07 (1H, m), 3.18-3.47 (4H, m), 3.56 (1H, d, J=20.5 Hz), 3.68 (3H, s), 3.92 (3H, s), 4.19 91H, d, J=6.4 Hz), 6.33 (1H, s), 6.77 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.84 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.39-7.46 (2H, m), 7.80-7.82 (1H, m), 7.99-8.04 (2H, m), 8.16 (1H, d, J=6.8 Hz), 8.22 (1H, s), 8.81 (1H, d, J=8.8 Hz), 9.12 (1.2H, s br).</p>	<p>融点 255 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₄H₃₄N₂O₅S · 1.2CH₃SO₃H · 1.5H₂O 計算値 C, 60.90; H, 5.45; N, 3.62; S, 9.15. 実測値 C, 60.79; H, 5.33; N, 3.74; S, 9.15. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 1702, 1638, 1560, 1543, 1510, 1450, 1363, 1199, 1176, 1125, 1050, 967, 895, 779, 756. Mass (FAB) 630 (M⁺+H⁺).</p>
<p>化合物 55 メタンスルホン酸塩 収率 66 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (300 MHz, DMSO-d₆) 0.39-0.56 (2H, m), 0.59-0.80 (2H, m), 1.04-1.17 (1H, m), 1.91 (1H, d, J=10.7 Hz), 2.30 (3H, s), 2.50-2.81 (3H, m), 2.94-3.03 (1H, m), 3.02 (1H, d, J=17.3 Hz), 3.15 (1H, br d, J=9.6 Hz), 3.24-3.52 (3H, m), 3.56 (3H, s), 3.69 (3H, s), 4.15 (1H, d, J=6.0 Hz), 6.10 (1H, s), 6.23 (1H, s), 6.78 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.87 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.31 (1H, t, J=7.1 Hz), 7.42 (1H, dt, J=1.3, 7.8 Hz), 7.49 (1H, d, J=7.4 Hz), 7.96 (1H, d, J=8.2 Hz), 9.04 (1H, br s).</p>	<p>融点 270 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₄H₃₄N₂O₅S · CH₃SO₃H · 1.1H₂O 計算値 C, 55.95; H, 5.86; N, 4.50; S, 10.30. 実測値 C, 55.78; H, 5.77; N, 4.67; S, 10.38. IR (cm⁻¹) (KBr) 3418, 1510, 1454, 1365, 1209, 1197, 1174, 1154, 1052, 775, 538. Mass (EI) 506 (M⁺). (塩フリー体のデータ)</p>

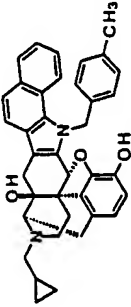
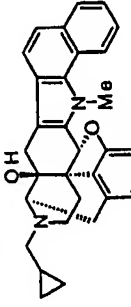
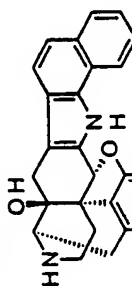
<p>化合物 <u>56</u> メタンスルホン酸塩 収率 48 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (300 MHz, DMSO-d₆) 0.38-0.57(2H, m), 0.57-0.80(2H, m), 1.02-1.17(1H, m), 1.95(1H, d, J=12.1Hz), 2.34(5-4H, s), 2.36(3H, s), 2.45-2.55(1H, m), 2.60-2.83(2H, m), 2.91-3.05(2H, m), 3.11-3.52(3H, m), 3.53(1H, d, J=20.0Hz), 3.82(3H, s), 4.13(1H, d, J=6.6Hz), 6.25(1H, s), 6.51(1H, br s), 6.78(1H, d, J=8.2Hz), 6.90(1H, d, J=8.2Hz), 7.22-7.30(1H, m), 7.33-7.47(4H, m), 7.97(1H, d, J=8.2Hz), 8.28(2H, d, J=8.2Hz), 9.04(1H, br s).</p>	<p>融点 140 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₁H₃₃N₂O₅S · 1.8CH₃SO₃H · 0.8H₂O 計算値 C, 55.83; H, 5.60; N, 3.64; S, 11.66. 実測値 C, 55.58; H, 5.70; N, 3.84; S, 11.86. IR (cm⁻¹) (KBr) 3414, 1638, 1510, 1454, 1369, 1210, 1195, 1176, 1125, 1060, 785, 665, 578, 561, 538. Mass (EI) 582 (M⁺). (塩フリー体のデータ)</p>
<p>化合物 <u>57</u> メタンスルホン酸塩 収率 42 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (300 MHz, DMSO-d₆) 0.40-0.58(2H, m), 0.58-0.81(2H, m), 1.04-1.17(1H, m), 1.96(1H, d, J=11.5Hz), 2.32(4.2H, s), 2.57-2.84(3H, m), 2.95-3.06(2H, m), 3.18(1H, br d, J=11.0Hz), 3.30-3.49(2H, m), 3.49-3.63(1H, m), 3.61(3H, s), 4.16(1H, d, J=6.6Hz), 5.15(1H, d, J=13.6Hz), 5.23(1H, d, J=13.6Hz), 6.14(1H, s), 6.62(1H, br s), 6.84(1H, d, J=8.5Hz), 6.95(1H, d, J=8.5Hz), 7.00-7.25(7H, m), 7.28(1H, d, J=8.2Hz), 7.36(1H, d, J=7.7Hz), 9.07(1H, br s).</p>	<p>融点 155 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₁H₃₃N₂O₅S · 1.4CH₃SO₃H · 0.9H₂O 計算値 C, 57.97; H, 5.69; N, 3.82; S, 10.49. 実測値 C, 57.77; H, 5.75; N, 3.96; S, 10.76. IR (cm⁻¹) (KBr) 3430, 1638, 1611, 1508, 1454, 1369, 1199, 1170, 1151, 1123, 1052, 785, 534. Mass (EI) 582 (M⁺). (塩フリー体のデータ)</p>
<p>化合物 <u>58</u> メタンスルホン酸塩 収率 53 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.38-0.56(2H, m), 0.59-0.79(2H, m), 1.03-1.17(1H, m), 1.88(1H, d, J=11.2Hz), 2.29(3.3H, s), 2.56(1H, d, J=17.1Hz), 2.58-2.77(2H, m), 2.92(3H, s), 2.93-3.03(1H, m), 3.01(1H, d, J=17.1Hz), 3.15(1H, br d, J=10.3Hz), 3.24-3.46(2H, m), 3.51(1H, d, J=20.0Hz), 3.68(3H, s), 4.14(1H, d, J=6.3Hz), 6.29(1H, s), 6.48(1H, s), 6.75(1H, d, J=8.3Hz), 6.82(1H, d, J=8.3Hz), 7.28(1H, t, J=7.3Hz), 7.39(1H, t, J=7.3Hz), 7.45(1H, d, J=7.3Hz), 8.15(1H, d, J=8.3Hz), 9.02(1H, br s).</p>	<p>融点 185 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₁H₃₃N₂O₄ · 1.1CH₃SO₃H · 0.8H₂O · 0.1Et₂O 計算値 C, 61.25; H, 6.24; N, 4.68; S, 5.90. 実測値 C, 61.26; H, 6.20; N, 4.86; S, 5.94. IR (cm⁻¹) (KBr) 3426, 1698, 1510, 1454, 1377, 1209, 1195, 1052. Mass (FAB) 471 ((M+H)⁺).</p>

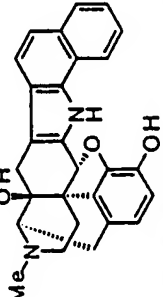
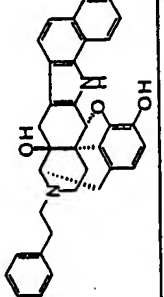
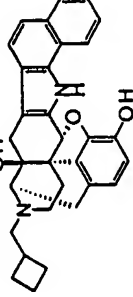
<p>化合物 59 メタンスルホン酸塩 収率 77 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.45 (m, 1H), 0.49 (m, 1H), 0.64 (m, 1H), 0.73 (m, 1H), 1.10 (m, 1H), 1.86 (br d, 1H, J=11.2 Hz), 2.19 (m, 1H), 2.27 (m, 1H), 2.30 (s, 3H), 2.56 (d, 1H, J=16.1 Hz), 2.63 (m, 1H), 2.72 (m, 1H), 2.95 (m, 1H), 2.97 (d, 1H, J=16.1 Hz), 3.14 (m, 1H), 3.26 (dd, 1H, J=20.0, 6.8 Hz), 3.39 (m, 1H), 3.45 (d, 1H, J=20.0 Hz), 3.77 (dt, 1H, J=14.6, 6.8 Hz), 3.86 (dt, 1H, J=14.6, 6.8 Hz), 4.09 (d, 1H, J=6.4 Hz), 4.37 (br t, 2H, J=7.3 Hz), 5.91 (s, 1H), 6.33 (br s, 1H, OH), 6.61 (d, 1H, J=8.1 Hz), 6.64 (d, 1H, J=8.1 Hz), 7.04 (br t, 1H, J=7.6 Hz), 7.21 (br t, 1H, J=7.6 Hz), 7.39 (d, 1H, J=7.8 Hz), 7.49 (d, 1H, J=8.3 Hz), 8.92 (br s, 1H, NH⁺), 9.23 (br s, 1H, OH).</p>	<p>融点 135-180 (°C). 元素分析値 組成式 C₄₀H₃₉N₃O₄·1.05MeSO₃H·1.0 H₂O 計算値 C, 66.21; H, 6.12; N, 5.64; S, 4.52. 実測値 C, 66.16; H, 6.14; N, 5.73; S, 4.69. IR (cm⁻¹) (KBr) 3380, 3254, 2188, 2116, 1649, 1638, 1628, 1508, 1644, 1433, 1377, 1330, 1189, 1116, 1044, 949, 924, 777, 746. Mass (FAB) 514 ((M+H)⁺).</p>
<p>化合物 60 メタンスルホン酸塩 収率 69 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.47 (m, 1H), 0.50 (m, 1H), 0.65 (m, 1H), 0.74 (m, 1H), 1.12 (m, 1H), 1.90 (br d, 1H, J=12.2 Hz), 2.26 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 2.38 (m, 1H), 2.64 (d, 1H, J=16.1 Hz), 2.67 (m, 1H), 2.76 (m, 1H), 2.96 (m, 1H), 3.07 (d, 1H, J=16.1 Hz), 3.16 (br d, 1H, J=10.2 Hz), 3.29 (dd, 1H, J=20.0, 6.8 Hz), 3.39 (m, 1H), 3.48 (d, 1H, J=20.0 Hz), 3.93-4.07 (m, 2H), 4.12 (d, 1H, J=6.3 Hz), 4.74-4.92 (m, 2H), 6.02 (s, 1H), 6.38 (s, 1H, OH), 6.62 (d, 1H, J=8.1 Hz), 6.64 (d, 1H, J=8.1 Hz), 7.46-7.56 (m, 3H), 7.65 (br t, 1H, J=7.6 Hz), 7.99 (d, 1H, J=7.8 Hz), 8.43 (d, 1H, J=8.8 Hz), 8.96 (br s, 1H, NH⁺), 9.25 (br s, 1H, OH).</p>	<p>融点 >205 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₄H₃₃N₃O₃·MeSO₃H·1.0 H₂O 計算値 C, 62.02; H, 5.80; N, 6.20; S, 9.46. 実測値 C, 62.07; H, 5.86; N, 6.12; S, 9.51. IR (cm⁻¹) (KBr) 3392, 3280, 2188, 2114, 1638, 1620, 1058, 1466, 1423, 1396, 1379, 1328, 1180, 1114, 1046, 853, 808, 779, 748. Mass (FAB) 564 ((M+H)⁺).</p>
<p>化合物 61 塩酸塩 収率 67 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.43 (m, 1H), 0.51 (m, 1H), 0.63 (m, 1H), 0.73 (m, 1H), 1.11 (m, 1H), 1.78 (br d, 1H, J=11.2 Hz), 2.03-2.22 (m, 2H), 2.54 (d, 1H, J=16.1 Hz), 2.58-2.78 (m, 2H), 2.97 (m, 1H), 2.99 (d, 1H, J=16.1 Hz), 3.11 (m, 1H), 3.22-3.50 (m, 5H), 4.12 (d, 1H, J=5.9 Hz), 4.28-4.43 (2H, m), 5.90 (s, 1H), 6.40 (s, 1H, OH), 6.60 (d, 1H, J=8.1 Hz), 6.63 (d, 1H, J=8.1 Hz), 7.01 (br t, 1H, J=7.3 Hz), 7.16 (br t, 1H, J=7.3 Hz), 7.37 (d, 1H, J=7.8 Hz), 7.45-7.57 (m, 4H), 7.88 (br d, 2H, J=6.8 Hz), 8.66 (t, 1H, J=5.4 Hz, CONH), 8.99 (br s, 1H, NH⁺), 9.23 (s, 1H, OH).</p>	<p>融点 >195 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₆H₃₇N₃O₄·HCl·0.9H₂O 計算値 C, 68.81; H, 6.38; Cl, 5.64; N, 6.69. 実測値 C, 68.87; H, 6.45; Cl, 5.63; N, 6.73. IR (cm⁻¹) (KBr) 3380, 3162, 1638, 1576, 1543, 1462, 1377, 1309, 1243, 1189, 1116, 1058, 1029, 1013, 949, 928, 866, 845, 801, 745, 706. Mass (FAB) 576 ((M+H)⁺).</p>

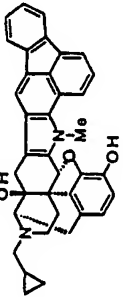
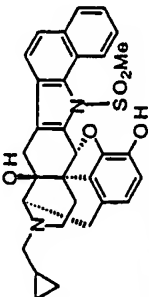
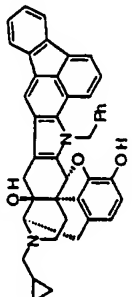
<p>化合物 62 塩酸塩 収率 73 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.43 (m, 1H), 0.51 (m, 1H), 0.63 (m, 1H), 0.73 (m, 1H), 1.11 (m, 1H), 1.25-1.35 (m, 2H), 1.52-1.63 (m, 4H), 1.81 (br d, 1H, J=10.8 Hz), 1.90-2.05 (m, 2H), 2.12 (t, 2H, J=7.3 Hz), 2.53-2.75 (m, 4H), 2.97 (m, 1H), 2.99 (d, 1H, J=16.1 Hz), 3.07-3.48 (m, 7H), 4.12 (d, 1H, J=6.3 Hz), 4.20-4.34 (2H, m), 5.87 (s, 1H), 6.40 (s, 1H, OH), 6.60 (d, 1H, J=8.1 Hz), 6.64 (d, 1H, J=8.1 Hz), 7.01 (br t, 1H, J=7.5 Hz), 7.12-7.27 (m, 6H), 7.37 (d, 1H, J=7.8 Hz), 7.46 (d, 1H, J=8.3 Hz), 8.02 (t, 1H, J=5.4 Hz, CONH), 8.99 (br s, 1H, NH⁺), 9.22 (s, 1H, OH).</p>	<p>融点 166-175 (°C). 元素分析値 組成式 C₄₁H₄₇N₃O₄·HCl·0.35H₂O 計算値 C, 71.51; H, 7.13; Cl, 5.15; N, 6.10. 実測値 C, 71.30; H, 7.09; Cl, 5.42; N, 6.35. IR (cm⁻¹) (KBr) 3380, 3196, 1638, 1543, 1508, 1460, 1377, 1328, 1394, 1243, 1189, 1116, 1060, 1029, 1013, 948, 926, 862, 799, 743. Mass (FAB) 646 (M+H⁺).</p>
<p>化合物 63 メタンスルホン酸塩 収率 60 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.45 (m, 1H), 0.48 (m, 1H), 0.63 (m, 1H), 0.73 (m, 1H), 1.09 (m, 1H), 1.83 (br d, 1H, J=11.7 Hz), 1.97-2.15 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.57 (d, 1H, J=16.1 Hz), 2.63 (m, 1H), 2.72 (m, 1H), 2.96 (m, 1H), 2.97 (d, 1H, J=16.1 Hz), 3.12 (br d, 1H, J=10.3 Hz), 3.27 (dd, 1H, J=20.0, 6.3 Hz), 3.32-3.42 (m, 3H), 3.44 (d, 1H, J=20.0 Hz), 4.09 (d, 1H, J=6.4 Hz), 4.28-4.40 (m, 2H), 5.91 (s, 1H), 6.34 (br s, 1H, OH), 6.60 (d, 1H, J=8.3 Hz), 6.63 (d, 1H, J=8.3 Hz), 6.85 (d, 1H, J=16.1 Hz), 7.02 (t, 1H, J=7.3 Hz), 7.19 (t, 1H, J=7.8 Hz), 7.38 (d, 1H, J=7.8 Hz), 7.50 (d, 1H, J=8.3 Hz), 7.55 (d, 1H, J=16.1 Hz), 7.67 (t, 1H, J=7.8 Hz), 7.74 (d, 1H, J=7.8 Hz), 7.91 (d, 1H, J=7.8 Hz), 7.95 (s, 1H), 8.36 (t, 1H, J=5.4 Hz, NH), 8.94 (br s, 1H, NH⁺), 9.20 (br s, 1H, OH).</p>	<p>融点 160-185 (°C). 元素分析値 組成式 C₃₉H₃₈F₃N₃O₄·1.2MeSO₃H·0.7H₂O 計算値 C, 60.53; H, 5.59; F, 7.15; N, 5.27; S, 4.82. 実測値 C, 60.36; H, 5.72; F, 7.20; N, 5.35; S, 4.92. IR (cm⁻¹) (KBr) 3252, 1663, 1620, 1560, 1510, 1462, 1437, 1377, 1336, 1170, 1118, 1071, 1044, 978, 862, 801, 775, 746. Mass (FAB) 670 (M+H⁺).</p>
<p>化合物 64 メタンスルホン酸塩 収率 73 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.46 (m, 1H), 0.50 (m, 1H), 0.64 (m, 1H), 0.74 (m, 1H), 1.12 (m, 1H), 1.83 (1H, br d, J=11.2 Hz), 2.18 (m, 1H), 2.30 (s, 3H), 2.31 (m, 1H), 2.59-2.80 (m, 2H), 2.64 (d, 1H, J=16.1 Hz), 2.96 (m, 1H), 3.06 (d, 1H, J=16.1 Hz), 3.13 (m, 1H), 3.28 (dd, 1H, J=20.0, 6.2 Hz), 3.39 (m, 1H), 3.46 (d, 1H, J=20.0 Hz), 3.55-3.64 (m, 2H), 4.11 (d, 1H, J=6.4 Hz), 4.72-4.88 (m, 2H), 6.03 (s, 1H), 6.35 (s, 1H, OH), 6.61 (d, 1H, J=8.3 Hz), 6.64 (d, 1H, J=8.3 Hz), 7.23 (t, 1H, J=7.3 Hz), 7.38 (t, 1H, J=7.3 Hz), 7.49-7.61 (m, 5H), 7.93-7.98 (m, 3H), 8.37 (d, 1H, J=8.3 Hz), 8.87 (t, 1H, J=5.6 Hz, NH), 8.96 (br s, 1H, NH⁺), 9.23 (s, 1H, OH).</p>	<p>融点 185-225 (°C). 元素分析値 組成式 C₄₀H₃₈N₃O₄·1.05MeSO₃H·1.01H₂O 計算値 C, 66.21; H, 6.12; N, 5.64; S, 4.52. 実測値 C, 66.16; H, 6.14; N, 5.73; S, 4.69. IR (cm⁻¹) (KBr) 3296, 1638, 1543, 1510, 1491, 1460, 1423, 1396, 1379, 1315, 1162, 1116, 1044, 853, 804. Mass (FAB) 626 (M+H⁺).</p>

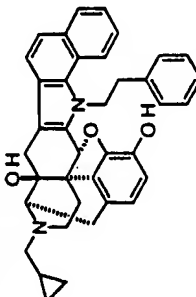
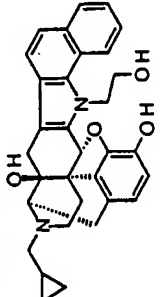
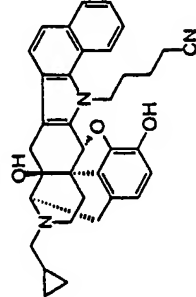
<p>化合物 66 メタンスルホン酸塩 収率 62 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.45 (m, 1H), 0.51 (m, 1H), 0.65 (m, 1H), 0.74 (m, 1H), 1.12 (m, 1H), 1.83 (br d, 1H, J=11.7 Hz), 2.14 (m, 1H), 2.26 (m, 1H), 2.30 (s, 3H), 2.64 (d, 1H, J=16.1 Hz), 2.63-2.80 (m, 2H), 2.96 (m, 1H), 3.07 (d, 1H, J=16.1 Hz), 3.13 (br d, 1H, J=9.8 Hz), 3.27 (dd, 1H, J=20.0, 6.4 Hz), 3.36-3.53 (m, 4H), 4.11 (d, 1H, J=6.3 Hz), 4.69-4.88 (m, 2H), 6.03 (s, 1H), 6.36 (br s, 1H), 6.61 (d, 1H, J=8.3 Hz), 6.64 (d, 1H, J=8.3 Hz), 6.91 (d, 1H, J=16.1 Hz), 7.41 (br t, 1H, J=7.6 Hz), 7.47-7.56 (m, 3H), 7.61 (d, 1H, J=16.1 Hz), 7.68 (t, 1H, J=7.8 Hz), 7.76 (d, 1H, J=7.8 Hz), 7.92-7.98 (m, 3H), 8.40 (d, 1H, J=8.8 Hz), 8.54 (t, 1H, J=5.9 Hz, NH), 8.96 (br s, 1H, NH'), 9.22 (br s, 1H, OH).</p>	<p>融点 200-215 (°C). 元素分析値 組成式 C₃₃H₄₀F₃N₃O₄·1.1MeSO₃H·0.7H₂O 計算値 C, 63.20; H, 5.51; F, 6.80; N, 5.01; S, 4.21. 実測値 C, 63.00; H, 5.62; F, 6.97; N, 5.06; S, 4.23. IR (cm⁻¹) (KBr) 3242, 1663, 1620, 1560, 1510, 1460, 1437, 1396, 1334, 1274, 1125, 1071, 1044, 980, 903, 853, 804, 775, 748. Mass (FAB) 720 (M+H⁺).</p>
<p>化合物 66 メタンスルホン酸塩 収率 88 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.46 (m, 1H), 0.51 (m, 1H), 0.66 (m, 1H), 0.75 (m, 1H), 1.12 (m, 1H), 1.83 (1H, br d, J=11.2 Hz), 2.22 (m, 1H), 2.32 (m, 1H), 2.35 (s, 6H), 2.60-2.82 (m, 2H), 2.64 (d, 1H, J=16.1 Hz), 2.97 (m, 1H), 3.07 (d, 1H, J=16.1 Hz), 3.15 (m, 1H), 3.29 (dd, 1H, J=19.5, 6.8 Hz), 3.40 (m, 1H), 3.47 (d, 1H, J=19.5 Hz), 3.58-3.67 (m, 2H), 4.11 (d, 1H, J=6.4 Hz), 4.74-4.90 (m, 2H), 6.04 (s, 1H), 6.30-7.20 (m, 3H, OH, NH+), 6.61 (d, 1H, J=8.3 Hz), 6.64 (d, 1H, J=8.3 Hz), 7.32 (t, 1H, J=7.8 Hz), 7.41 (t, 1H, J=7.8 Hz), 7.47-7.53 (m, 2H), 7.82 (dd, 1H, J=7.8, 5.4 Hz), 7.96 (d, 1H, J=7.8 Hz), 8.39 (d, 1H, J=7.8 Hz), 8.55 (br d, 1H, J=7.8 Hz), 8.88 (dd, 1H, J=5.4, 1.5 Hz), 8.95 (m, 1H, NH'), 9.17 (t, 1H, J=5.6 Hz, NH), 9.20 (d, 1H, J=1.5 Hz).</p>	<p>融点 >175 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₈H₃₈N₄O₄·2.3MeSO₃H·0.7H₂O·0.9EtOAc 計算値 C, 57.39; H, 5.99; N, 5.96; S, 8.03. 実測値 C, 57.35; H, 5.78; N, 6.05; S, 8.03. IR (cm⁻¹) (KBr) 3380, 1663, 1636, 1543, 1508, 1460, 1423, 1377, 1317, 1197, 1116, 1052, 853, 810, 785. Mass (FAB) 627 (M+H⁺).</p>
<p>化合物 67 メタンスルホン酸塩 収率 73 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.46 (m, 1H), 0.51 (m, 1H), 0.65 (m, 1H), 0.75 (m, 1H), 1.11 (m, 1H), 1.85 (1H, br d, J=11.6 Hz), 2.13-2.33 (m, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.646 (d, 1H, J=16.2 Hz), 2.62-2.80 (m, 2H), 2.97 (m, 1H), 3.07 (d, 1H, J=16.2 Hz), 3.14 (m, 1H), 3.29 (dd, 1H, J=19.8, 6.8 Hz), 3.41 (m, 1H), 3.47 (d, 1H, J=19.8 Hz), 3.75 (m, 2H), 4.11 (d, 1H, J=6.4 Hz), 4.65-4.85 (m, 4H), 6.01 (s, 1H), 6.36 (br s, 1H, OH), 6.61 (d, 1H, J=8.1 Hz), 6.64 (d, 1H, J=8.1 Hz), 7.18-7.36 (m, 5H), 7.42-7.60 (m, 3H), 7.87 (br s, 1H, NH), 7.96 (br d, 1H, J=8.1 Hz), 8.08 (br s, 1H, NH), 8.40 (d, 1H, J=8.5 Hz), 8.95 (br s, 1H, NH'), 9.21 (br s, 1H, OH).</p>	<p>融点 180-205 (°C). 元素分析値 組成式 C₃₈H₃₈N₄O₄·2.3MeSO₃H·0.7H₂O·0.9EtOAc 計算値 C, 57.39; H, 5.99; N, 5.96; S, 8.03. 実測値 C, 57.35; H, 5.78; N, 6.05; S, 8.03. IR (cm⁻¹) (KBr) 3260, 1638, 1620, 1551, 1508, 1460, 1423, 1396, 1377, 1328, 1200, 1156, 1114, 1042, 948, 851, 806, 777, 745. Mass (FAB) 671 (M+H⁺).</p>

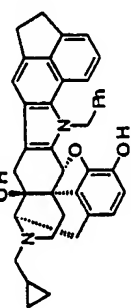
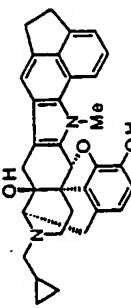
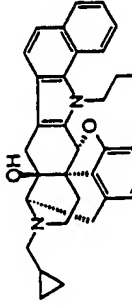
<p>化合物 68 メタンスルホン酸塩 収率 72 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.42-0.54 (2H, m), 0.61-0.78 (2H, m), 1.10 (1H, m), 1.85 (1H, d, J=11.2 Hz), 2.30 (3H, s), 2.54-2.78 (3H, m), 2.96 (1H, m), 3.03 (1H, d, J=16.1 Hz), 3.13 (1H, d, J=11.7 Hz), 3.27-3.49 (3H, m), 4.10 (1H, d, J=6.3 Hz), 5.41 (1H, d, J=16.1 Hz), 5.64 (1H, d, J=16.6 Hz), 5.85 (1H, s), 6.36 (1H, br s), 6.64 (1H, d, J=16.6 Hz), 6.66 (1H, d, J=16.1 Hz), 7.00 (1H, m), 7.09 (1H, m), 7.23-7.34 (6H, m), 7.40 (1H, d, J=7.8 Hz), 8.94 (1H, br s), 9.26 (1H, br s).</p>	<p>融点 262-278 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₁H₃₂N₂O₃·CH₃SO₃H·1.5H₂O 計算値 C, 65.05; H, 6.26; N, 4.46; S, 5.11. 実測値 C, 64.90; H, 6.29; N, 4.38; S, 5.40. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 1508, 1460, 1193, 1044, 779, 743, 549. Mass (FAB) 505 ((M+H)⁺).</p>
<p>化合物 69 メタンスルホン酸塩 収率 62 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.42-0.55 (m, 2H), 0.60-0.69 (m, 1H), 0.71-0.80 (m, 1H), 1.06-1.18 (m, 1H), 1.81-1.89 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 2.54-2.65 (m, 1H), 2.67-2.80 (m, 2H), 2.93-3.02 (m, 1H), 3.09-3.20 (m, 2H), 3.28-3.53 (m, 3H), 4.13 (d, J=6.3 Hz, 1H), 5.89 (s, 1H), 5.98 (d, J=18.1 Hz, 1H), 6.11 (d, J=18.1 Hz, 1H), 6.39 (br s, 1H), 6.65 (m, 2H), 7.06-7.12 (m, 2H), 7.18-7.37 (m, 5H), 7.52 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.56 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.87-7.93 (m, 1H), 8.15-8.22 (m, 1H), 8.96 (br s, 1H), 9.16 (br s, 1H).</p>	<p>融点 291-306 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₇H₃₄N₂O₃·CH₃SO₃H·1.6H₂O 計算値 C, 67.16; H, 6.09; N, 3.92; S, 4.72. 実測値 C, 67.20; H, 6.09; N, 3.92; S, 4.74. IR (cm⁻¹) (KBr) 3410, 1655, 1636, 1510, 1460, 1398. Mass (FAB) 555 ((M+H)⁺).</p>
<p>化合物 70 メタンスルホン酸塩 収率 61 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (300 MHz, DMSO-d₆) 0.51-0.58 (2H, m), 0.60-0.80 (2H, m), 1.12 (1H, m), 1.85 (1H, d, J=11.0 Hz), 2.29 (3H, s), 2.53-2.80 (3H, m), 2.97 (1H, m), 3.03-3.19 (2H, m), 3.27-3.52 (3H, m), 4.13 (1H, d, J=4.9 Hz), 5.95 (1H, s), 5.98 (1H, d, J=17.9 Hz), 6.07 (1H, d, J=17.9 Hz), 6.41 (1H, s), 6.62-6.67 (2H, m), 7.04-7.09 (4H, m), 7.34 (1H, d, J=3.3 Hz), 7.36 (1H, d, J=3.3 Hz), 7.51-7.58 (2H, m), 7.91 (1H, dd, J=6.0, 3.6 Hz), 8.16-8.19 (1H, m), 8.97 (1H, br s), 9.16 (1H, s).</p>	<p>融点 >200 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₇H₃₃FN₂O₃·CH₃SO₃H·0.7H₂O 計算値 C, 66.98; H, 5.68; F, 2.79; N, 4.11; S, 4.71. 実測値 C, 66.81; H, 5.90; F, 2.83; N, 4.34; S, 4.72. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 1510, 1396, 1328, 1222, 1160, 1118, 1046, 853, 808. Mass (FAB) 573 ((M+H)⁺).</p>

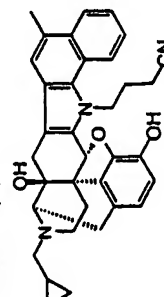
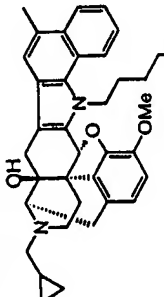
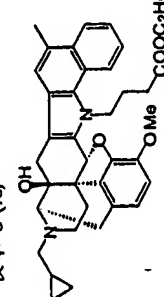
<p>化合物 71 メタンスルホン酸塩 収率 71 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (300 MHz, DMSO-d₆) 0.42-0.55 (2H, m), 0.60-0.80 (2H, m), 1.12 (1H, m), 1.85 (1H, d, J=11.8 Hz), 2.23 (3H, s), 2.29 (3H, s), 2.44-2.80 (3H, m), 2.97 (1H, m), 3.09-3.20 (2H, m), 3.27-3.54 (3H, m), 4.13 (1H, d, J=6.3 Hz), 5.87 (1H, s), 5.90-6.08 (2H, m), 6.40 (1H, s), 6.62-6.68 (2H, m), 6.98 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.07 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.33 (1H, d, J=3.3 Hz), 7.35 (1H, d, J=3.3 Hz), 7.52 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.56 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.90 (1H, dd, J=6.0, 3.6 Hz), 8.19 (1H, dd, J=6.3, 3.6 Hz), 8.97 (1H, br s), 9.20 (1H, s).</p>	<p>融点 >250 (dec). (°C). 元素分析値 組成式 C₃₇H₃₆N₂O₃·1.05C₆H₅SO₃H·1.5H₂O 計算値 C, 67.33; H, 6.25; N, 4.02; S, 4.83. 実測値 C, 67.07; H, 6.24; N, 4.33; S, 4.68. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 1514, 1460, 1392, 1365, 1307, 1253, 1195, 1180, 1048, 1033, 810, 748. Mass (FAB) 569 (M+H)⁺.</p>
<p>化合物 72 メタンスルホン酸塩 収率 77 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.40-0.56 (m, 2H), 0.60-0.69 (m, 1H), 0.70-0.80 (m, 1H), 1.05-1.16 (m, 1H), 1.84-1.93 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 2.59-2.81 (m, 2H), 2.64 (d, J=16.1 Hz, 1H), 2.90-3.00 (m, 1H), 3.07 (d, J=16.1 Hz, 1H), 3.11-3.18 (m, 1H), 3.23-3.32 (m, 1H), 3.37-3.46 (m, 1H), 3.47 (d, J=19.5 Hz, 1H), 4.11 (d, J=6.8 Hz, 1H), 4.33 (s, 3H), 6.03 (s, 1H), 6.34 (s, 1H), 6.61 (d, J=8.3 Hz, 1H), 6.64 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.43-7.53 (m, 3H), 7.55-7.62 (m, 1H), 7.97 (d, J=7.8 Hz, 1H), 8.63 (d, J=7.8 Hz, 1H), 8.96 (br s, 1H), 9.23 (s, 1H).</p>	<p>融点 267-274 (°C). 元素分析値 組成式 C₃₁H₃₀N₂O₃·CH₃SO₃H·0.8H₂O 計算値 C, 65.24; H, 6.09; N, 4.76; S, 5.44. 実測値 C, 65.24; H, 6.11; N, 4.62; S, 5.39. IR (cm⁻¹) (KBr) 3410, 1622, 1510, 1460, 1398, 1207, 1048. Mass (FAB) 479 (M+H)⁺.</p>
<p>化合物 73 メタンスルホン酸塩 収率 31 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 1.79 (m, 1H), 2.31 (s, 2.9 H), 2.50-2.61 (m, 2H), 2.70-2.80 (m, 1H), 2.96 (d, J=15.6 Hz, 1H), 3.08-3.15 (m, 1H), 3.16 (d, J=19.5 Hz, 1H), 3.38 (dd, J=19.5, 6.8 Hz, 1H), 3.83 (d, J=6.8 Hz, 1H), 5.75 (s, 1H), 6.06 (br s, 1H), 6.60 (d, J=8.3 Hz, 1H), 6.63 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.41 (dd, J=7.3, 1.0 Hz, 1H), 7.43 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.48 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.54 (dd, J=7.3, 1.0 Hz, 1H), 7.89 (d, J=8.3 Hz, 1H), 8.42 (d, J=8.3 Hz, 1H), 8.44-8.84 (br s, 2H), 9.20 (br s, 1H), 12.2 (br s, 1H).</p>	<p>融点 273-279 (°C). 元素分析値 組成式 C₃₁H₃₀N₂O₃·CH₃SO₃H·0.71H₂O·0.65EtOAc 計算値 C, 61.67; H, 5.70; N, 4.86; S, 5.56. 実測値 C, 61.95; H, 5.81; N, 4.59; S, 5.34. IR (cm⁻¹) (KBr) 3200, 1707, 1638, 1620, 1508, 1464, 1377, 1323, 1280, 1214, 1199, 1172, 1154, 1040, 868. Mass (FAB) 411 (M+H)⁺.</p>

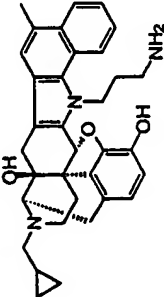
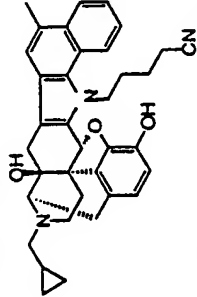
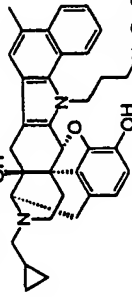
<p>化合物 74 メタンスルホン酸塩 収率 56 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (300 MHz, DMSO-d₆) 1.79 (m, 1H), 2.31 (s, 2.9 H), 2.50-2.61 (m, 2H), 2.70-2.80 (m, 1H), 2.96 (d, J=15.6 Hz, 1H), 3.08-3.15 (m, 1H), 3.16 (d, J=19.5 Hz, 1H), 3.38 (dd, J=19.5, 6.8 Hz, 1H), 3.83 (d, J=6.8 Hz, 1H), 5.75 (s, 1H), 6.06 (br s, 1H), 6.60 (d, J=8.3 Hz, 1H), 6.63 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.41 (d, J=7.3, 1.0 Hz, 1H), 7.43 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.48 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.54 (d, J=7.3, 1.0 Hz, 1H), 7.89 (d, J=8.3 Hz, 1H), 8.60 (br s, 1H), 9.20 (br s, 1H), 12.2 (br s, 1H).</p>	<p>融点 334-340 (°C). 元素分析値 組成式 C₂₇H₁₈N₂O₃·CH₃SO₃H·0.4H₂O 計算値 C, 63.72; H, 5.50; N, 5.31; S, 6.08. 実測値 C, 63.78; H, 5.68; N, 5.22; S, 6.02. IR (cm⁻¹) (KBr) 3384, 3232, 1626, 1508, 1468, 1392, 1325, 1207, 1174, 1042, 818. Mass (FAB) 411 (M+H)⁺.</p>
<p>化合物 75 メタンスルホン酸塩 収率 60 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 1.84-1.93 (m, 1H), 2.30 (s, 3.2 H), 2.59-2.72 (m, 1H), 2.63 (d, J=15.6 Hz, 1H), 2.76-2.95 (m, 2H), 3.02 (d, J=15.6 Hz, 1H), 3.44-3.34 (m, 4H), 3.57 (d, J=20.0 Hz, 1H), 3.56-3.69 (m, 1H), 4.00 (d, J=6.4 Hz, 1H), 5.81 (s, 1H), 6.36 (s, 1H), 6.62 (d, J=8.3 Hz, 1H), 6.65 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.26-7.59 (m, 9H), 7.90 (d, J=7.8 Hz, 1H), 8.43 (d, J=7.8 Hz, 1H), 9.17 (br s, 1H), 9.20 (s, 1H), 12.2 (s, 1H).</p>	<p>融点 273-280 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₁H₂₀N₂O₃·CH₃SO₃H·0.3H₂O 計算値 C, 68.23; H, 5.66; N, 4.55; S, 5.20. 実測値 C, 68.21; H, 5.75; N, 4.37; S, 5.31. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 1638, 1508, 1460, 1390, 1325, 1199, 1048, 812. Mass (FAB) 515 (M+H)⁺.</p>
<p>化合物 76 メタンスルホン酸塩 収率 54 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 1.80-1.98 (m, 5H), 2.02-2.12 (m, 1H), 2.14-2.23 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 2.58 (d, J=16.1 Hz, 1H), 2.60-2.69 (m, 1H), 2.69-2.83 (m, 2H), 3.00 (d, J=16.1 Hz, 1H), 3.05-3.18 (m, 2H), 3.23 (dd, J=19.5, 6.8 Hz, 1H), 3.40-3.53 (m, 1H), 3.45 (d, J=19.5 Hz, 1H), 3.62 (d, J=6.8 Hz, 1H), 5.78 (s, 1H), 6.29 (s, 1H), 6.60 (d, J=8.3 Hz, 1H), 6.64 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.48-7.50 (m, 3H), 7.55 (t, J=7.8 Hz, 1H), 7.89 (d, J=7.8 Hz, 1H), 8.42 (d, J=7.8 Hz, 1H), 8.88 (br s, 1H), 9.21 (br s, 1H), 12.3 (s, 1H).</p>	<p>融点 274 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₁H₂₀N₂O₃·CH₃SO₃H·0.2H₂O 計算値 C, 66.46; H, 6.00; N, 4.84; S, 5.54. 実測値 C, 66.56; H, 6.22; N, 4.91; S, 5.42. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 1626, 1508, 1464, 1427, 1390, 1328, 1199, 1116, 1046, 872. Mass (FAB) 479 (M+H)⁺.</p>

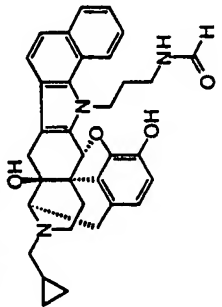
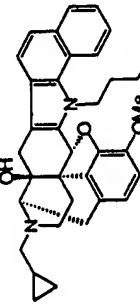
<p>化合物 77 リン酸塩 収率 83 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.22-0.30 (2H, m), 0.50-0.63 (2H, m), 0.93-1.04 (1H, m), 1.74 (1H, d, J=11.2 Hz), 2.33-2.49 (2H, m), 2.55-2.77 (2H, m), 2.67 (1H, d, J=15.6 Hz), 2.81-3.00 (2H, m), 3.02 (1H, d, J=16.1 Hz), 3.22 (1H, d, J=19.1 Hz), 3.58 (1H, m), 4.31 (3H, s), 5.00-6.00 (2H, br), 5.95 (1H, s), 6.54-6.58 (2H, m), 7.32-7.41 (2H, m), 7.79 (1H, dd, J=8.3, 6.8 Hz), 7.98 (1H, d, J=7.3 Hz), 8.01 (1H, d, J=7.3 Hz), 8.11 (1H, d, J=7.3 Hz), 8.21 (1H, s), 8.49 (1H, d, J=8.3 Hz).</p>	<p>融点 294 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₇H₃₂N₂O₅·H₃PO₄·0.8H₂O·0.2Et₂O 計算値 C, 66.78; H, 5.72; N, 4.12; P, 4.56. 実測値 C, 66.74; H, 5.76; N, 4.32; P, 4.36. IR (cm⁻¹) (KBr) 3408, 2988, 1620, 1562, 1510, 1452, 1394, 1315, 1263, 1176, 1031, 915, 859, 801, 565. Mass (FAB) 552 (M+H)⁺.</p>
<p>化合物 78 メタンスルホン酸塩 収率 61 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (300 MHz, DMSO-d₆) 0.40-0.54 (2H, m), 0.60-0.80 (2H, m), 1.08 (1H, m), 1.85 (1H, m), 2.35 (3H, s), 2.58 (1H, d, J=17.3 Hz), 2.63-2.78 (2H, m), 2.95 (1H, m), 3.08-3.18 (1H, m), 3.13 (1H, d, J=17.3 Hz), 3.22-3.44 (3H, m), 3.80 (3H, s), 4.16 (1H, d, J=6.3 Hz), 6.24 (1H, s), 6.57-6.63 (2H, m), 7.50-7.63 (2H, m), 7.56 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.84 (1H, d, J=8.5 Hz), 8.02 (1H, d, J=7.7 Hz), 8.67 (1H, d, J=8.5 Hz), 9.05 (1H, br s), 9.34 (1H, br s).</p>	<p>融点 232-243 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₁H₃₀N₂O₅S·1.15CH₃SO₃H·1.8H₂O 計算値 C, 56.32; H, 5.62; N, 4.09; S, 10.06. 実測値 C, 56.02; H, 5.58; N, 3.99; S, 10.28. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 1626, 1508, 1466, 1365, 1334, 1176, 1118, 1046, 803, 766, 551, 518. Mass (FAB) 543 (M+H)⁺.</p>
<p>化合物 79 メタンスルホン酸塩 収率 78 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.45-0.56 (2H, m), 0.65-0.72 (1H, m), 0.76-0.82 (1H, m), 1.10-1.19 (1H, m), 1.88 (1H, d, J=12.2 Hz), 2.32 (4.05H, s), 2.59-2.69 (1H, m), 2.73-2.87 (2H, m), 2.97-3.03 (1H, m), 3.14-3.18 (1H, m), 3.30 (1H, d, J=16.1 Hz), 3.55-3.51 (3H, m), 4.18 (1H, d, J=6.4 Hz), 5.94 (1H, s), 5.99 (1H, d, J=18.1 Hz), 6.13 (1H, d, J=17.6 Hz), 6.47 (1H, br s), 6.67-6.71 (1H, m), 7.13-7.15 (2H, m), 7.21-7.41 (5H, m), 7.58 (1H, dd, J=8.3, 7.3 Hz), 7.97-8.02 (3H, m), 8.07 (1H, d, J=8.8 Hz), 8.25 (1H, s), 9.00 (1.35H, br s), 9.20 (1H, br s).</p>	<p>融点 241 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₄₀H₃₆N₂O₅·1.35CH₃SO₃H·0.8H₂O 計算値 C, 68.92; H, 5.61; N, 3.62; S, 5.60. 実測値 C, 69.08; H, 5.74; N, 3.44; S, 5.68. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 1773, 1736, 1719, 1702, 1686, 1655, 1636, 1560, 1543, 1522, 1510, 1460, 1437, 1421, 1398, 1340, 1174, 1050, 777. Mass (FAB) 629 (M+H)⁺.</p>

<p>化合物 80 メタンスルホン酸塩 収率 59 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.40-0.56 (m, 2H), 0.60-0.69 (m, 1H), 0.70-0.79 (m, 1H), 1.04-1.16 (m, 1H), 1.79-1.88 (m, 1H), 2.30 (s, 3.3H), 2.50-2.62 (m, 1H), 2.66 (d, J=15.6 Hz, 1H), 2.68-2.80 (m, 1H), 2.91-3.00 (m, 1H), 3.11 (d, J=15.6 Hz, 1H), 3.12-3.22 (m, 2H), 3.22-3.48 (m, 4H), 3.46 (d, J=19.5 Hz, 1H), 4.10 (d, J=6.4 Hz, 1H), 4.85-4.98 (m, 1H), 5.75 (s, 1H), 6.31 (br s, 1H), 6.61 (d, J=8.3 Hz, 1H), 6.64 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.30-7.36 (m, 1H), 7.39-7.45 (m, 2H), 7.45-7.58 (m, 5H), 7.67-7.74 (m, 1H), 8.01 (dd, J=8.3, 1.0 Hz, 1H), 8.50 (d, J=8.3 Hz, 1H), 8.97 (br s, 1H), 9.25 (br s, 1H).</p>	<p>融点 190-230 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₄H₃₂N₂O₃·1.12Cl₃SO₃H·0.3H₂O 計算値 C, 68.92; H, 6.07; N, 4.11; S, 5.27. 実測値 C, 68.85; H, 6.22; N, 4.46; S, 4.95. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 2926, 1620, 1508, 1458, 1394, 1323, 1154, 1120, 1031, 853, 801. Mass (EI) 568 (M⁺). (塩フリー体のデータ)</p>
<p>化合物 81 メタンスルホン酸塩 収率 54 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (500 MHz, DMSO-d₆) 0.42-0.54 (m, 2H), 0.60-0.68 (m, 1H), 0.71-0.78 (m, 1H), 1.06-1.15 (m, 1H), 1.85-1.92 (m, 1H), 2.31 (s, 3.8H), 2.58-2.68 (m, 1H), 2.63 (d, J=15.6 Hz, 1H), 2.69-2.79 (m, 1H), 2.92-3.00 (m, 1H), 3.07 (d, J=15.6 Hz, 1H), 3.11-3.17 (m, 1H), 3.28 (dd, J=19.5, 6.8 Hz, 1H), 3.36-3.46 (m, 2H), 3.46 (d, J=19.5 Hz, 1H), 3.84-3.92 (m, 1H), 4.02-4.10 (m, 1H), 4.11 (d, J=6.8 Hz, 1H), 4.74-4.88 (m, 2H), 6.06 (s, 1H), 6.30 (br s, 1H), 6.61 (d, J=7.8 Hz, 1H), 6.64 (d, J=7.8 Hz, 1H), 7.44-7.54 (m, 3H), 7.58-7.64 (m, 1H), 7.97 (d, J=8.3 Hz, 1H), 8.45 (d, J=8.3 Hz, 1H), 8.97 (br s, 1H), 9.26 (br s, 1H).</p>	<p>融点 230-235 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₂H₃₂N₂O₃·1.2Cl₃SO₃H·2.0H₂O 計算値 C, 60.42; H, 6.23; N, 4.24; Cl, 5.83. 実測値 C, 60.21; H, 6.26; N, 4.41; Cl, 6.06. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 2926, 1620, 1508, 1460, 1396, 1323, 1064, 1031, 851, 803. Mass (EI) 508 (M⁺). (塩フリー体のデータ)</p>
<p>化合物 82 メタンスルホン酸塩 収率 81 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (300 MHz, DMSO-d₆) 0.40-0.57 (m, 2H), 0.57-0.70 (m, 1H), 0.70-0.80 (m, 1H), 1.03-1.15 (m, 1H), 1.80-2.08 (m, 5H), 2.29 (s, 3.3H), 2.54-2.80 (m, 5H), 2.90-3.02 (m, 1H), 3.07 (d, J=15.9 Hz, 1H), 3.10-3.21 (m, 1H), 3.21-3.53 (m, 3H), 4.11 (d, J=5.5 Hz, 1H), 4.64-4.86 (m, 1H), 6.02 (s, 1H), 6.37 (br s, 1H), 6.61 (d, J=8.2 Hz, 1H), 6.64 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.43-7.51 (m, 3H), 7.59-7.64 (m, 1H), 7.98 (d, J=8.0 Hz, 1H), 8.40 (d, J=8.8 Hz, 1H), 8.96 (br s, 1H), 9.23 (s, 1H).</p>	<p>融点 181-206 (°C). 元素分析値 組成式 C₃₃H₃₂N₂O₃·Cl₃SO₃H·0.71H₂O 計算値 C, 66.49; H, 6.39; N, 6.29; S, 4.80. 実測値 C, 66.34; H, 6.29; N, 6.40; S, 5.06. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 2926, 2252, 1638, 1620, 1504, 1460, 1394, 1323, 1290, 1154, 1118, 1031, 907, 853. Mass (EI) 545 (M⁺). (塩フリー体のデータ)</p>

<p>化合物 83 リン酸塩 収率 42 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.26 (m, 2H), 0.50-0.63 (m, 2H), 0.98 (m, 1H), 1.70 (m, 1H), 2.25-2.42 (m, 2H), 2.50-2.74 (m, 2H), 2.64 (d, 1H, J=15.6 Hz), 2.81 (m, 1H), 2.92 (d, 1H, J=15.6 Hz), 2.94 (m, 1H), 3.14-3.37 (m, 5H), 3.53 (m, 1H), 5.89 (s, 1H), 5.85 (br s, 5H, OH, NH'), 5.90 (d, 1H, J=18.1 Hz), 6.04 (d, 1H, J=18.1 Hz), 6.63-6.58 (m, 2H), 7.02 (d, 2H, J=7.3 Hz), 7.14-7.22 (m, 2H), 7.22-7.30 (m, 3H), 7.31 (s, 1H), 7.75 (d, 1H, J=8.3 Hz).</p>	<p>融点 >230 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₀H₃₂N₂O₃·0.95H₃PO₄·1.4H₂O 計算値 C, 67.01; H, 6.01; N, 4.01; P, 4.21. 実測値 C, 67.23; H, 5.84; N, 3.89; P, 4.04. IR (cm⁻¹) (KBr) 3332, 1638, 1620, 1510, 1460, 1412, 1315, 1245, 1168, 1118, 1060, 1031, 948, 926, 864, 797, 752. Mass (FAB) 581 (M+H)⁺.</p>
<p>化合物 84 リン酸塩 収率 63 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.26 (m, 2H), 0.49-0.65 (m, 2H), 0.97 (m, 1H), 1.71 (m, 1H), 2.32-2.98 (m, 6H), 2.55 (d, 1H, J=15.6 Hz), 2.84 (d, 1H, J=15.6 Hz), 3.15-3.32 (m, 3H), 3.33-3.42 (m, 2H), 3.55 (m, 1H), 4.25 (s, 3H), 4.92 (br s, 5H, OH, NH'), 5.88 (s, 1H), 6.52 (d, 1H, J=8.3 Hz), 6.55 (d, 1H, J=8.3 Hz), 7.25 (s, 1H), 7.27 (d, 1H, J=7.3 Hz), 7.49 (dd, 1H, J=8.3, 7.3 Hz), 8.19 (d, 1H, J=8.3 Hz).</p>	<p>融点 >230 (dec) (°C). 元素分析値 組成式 C₃₀H₃₂N₂O₃·1.05H₃PO₄·1.4H₂O 計算値 C, 62.64; H, 6.05; N, 4.43; P, 5.14. 実測値 C, 62.90; H, 5.79; N, 4.28; P, 4.98. IR (cm⁻¹) (KBr) 3350, 1638, 1620, 1508, 1450, 1406, 1313, 1243, 1170, 1116, 1062, 1031, 926, 859, 752. Mass (FAB) 505 (M+H)⁺.</p>
<p>化合物 85 メタンスルホン酸塩 収率 36 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (500 MHz, DMSO-d₆) 0.42-0.48 (m, 1H), 0.48-0.55 (m, 1H), 0.62-0.68 (m, 1H), 0.72-0.79 (m, 1H), 1.07-1.15 (m, 1H), 1.86-1.92 (m, 1H), 2.14-2.24 (m, 1H), 2.30 (s, 3.6H), 2.26-2.36 (m, 2H), 2.64 (d, J=16.1 Hz, 1H), 2.63-2.70 (m, 1H), 2.70-2.81 (m, 2H), 2.83-2.92 (m, 1H), 2.93-3.00 (m, 1H), 3.40-3.50 (m, 1H), 3.07 (d, J=16.1 Hz, 1H), 3.12-3.19 (m, 1H), 3.28 (dd, J=20.2, 6.8 Hz, 1H), 4.11 (d, J=6.8 Hz, 1H), 4.70-4.86 (m, 2H), 6.04 (s, 1H), 6.36 (br s, 1H), 6.62 (d, J=8.3 Hz, 1H), 6.64 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.46-7.56 (m, 3H), 7.59-7.64 (m, 1H), 7.99 (d, J=8.0 Hz, 1H), 8.42 (d, J=8.0 Hz, 1H), 8.90 (br s, 1H), 9.27 (br s, 1H).</p>	<p>融点 217-220 (°C). 元素分析値 組成式 C₃₁H₃₃N₃O₃·1.2CH₃SO₃H·0.8H₂O 計算値 C, 63.92; H, 6.00; N, 6.35; S, 5.82. 実測値 C, 63.87; H, 6.24; N, 6.23; S, 5.87. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 2250, 1638, 1626, 1508, 1462, 1423, 1396, 1328, 1313, 1195, 1060. Mass (FAB) 532 (M+H)⁺.</p>

化合物 86 メタンスルホン酸塩 収率 31 (%)		NMR (ppm) (300 MHz, DMSO-d ₆) 0.40-0.57 (m, 2H), 0.58-0.69 (m, 1H), 0.69-0.80 (m, 1H), 1.03-1.18 (m, 1H), 1.82-1.92 (m, 1H), 2.09-2.30 (m, 2H), 2.31 (s, 3.75H), 2.62 (s, 3H), 2.56-3.09 (m, 8H), 3.10-3.35 (m, 3H), 4.05-4.07 (m, 1H), 4.05-4.07 (m, 1H), 4.64-4.89 (m, 2H), 6.01 (s, 1H), 6.36 (br s, 1H), 6.59-6.68 (m, 2H), 7.37 (s, 1H), 7.49-7.58 (m, 1H), 7.60-7.68 (m, 1H), 8.06 (d, J=8.5 Hz, 1H), 8.44 (d, J=8.5 Hz, 1H), 8.96 (br s, 1H), 9.26 (br s, 1H).	融点 190 (°C). 元素分析値 組成式 C ₃₇ H ₃₉ N ₃ O ₃ ·1.4CH ₃ SO ₃ H·0.2H ₂ O 計算値 C, 63.93; H, 6.04; N, 6.14; S, 6.56. 実測値 C, 64.09; H, 6.15; N, 6.04; S, 6.22. IR (cm ⁻¹) (KBr) 3400, 2252, 1640, 1622, 1508, 1460, 1423, 1400, 1317, 1209, 1116, 1058, 1050. Mass (EI) 545 (M ⁺). (塩フリー体のデータ)
化合物 87 メタンスルホン酸塩 収率 97 (%)		NMR (ppm) (300 MHz, DMSO-d ₆) 0.40-0.56 (m, 2H), 0.60-0.70 (m, 1H), 0.70-0.80 (m, 1H), 1.04-1.18 (m, 1H), 1.70-2.04 (m, 5H), 2.30 (s, 4.6H), 2.53-2.80 (m, 5H), 2.82 (s, 3H), 2.88-3.05 (m, 1H), 3.06 (d, J=16.4 Hz, 1H), 3.10-3.21 (m, 1H), 3.32 (dd, J=19.5, 6.0 Hz, 1H), 3.33-3.47 (m, 1H), 3.53 (d, J=19.5 Hz, 1H), 3.69 (s, 3H), 4.12 (d, J=6.0 Hz, 1H), 4.60-4.82 (m, 2H), 6.06 (s, 1H), 6.37 (br s, 1H), 6.75 (d, J=8.2 Hz, 1H), 6.83 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.35 (s, 1H), 7.52 (t, J=7.4 Hz, 1H), 7.64 (t, J=8.3 Hz, 1H), 8.04 (d, J=7.7 Hz, 1H), 8.41 (d, J=7.7 Hz, 1H), 9.00 (br s, 1H).	融点 150 (°C). 元素分析値 組成式 C ₃₇ H ₃₉ N ₃ O ₃ ·1.5CH ₃ SO ₃ H·0.1H ₂ O 計算値 C, 64.25; H, 6.33; N, 5.84; S, 6.68. 実測値 C, 64.23; H, 6.48; N, 5.86; S, 6.49. IR (cm ⁻¹) (KBr) 3450, 3248, 1638, 1508, 1454, 1423, 1402, 1209, 1197, 1123, 1054, 893. Mass (EI) 573 (M ⁺). (塩フリー体のデータ)
化合物 88 収率 6 (%)		NMR (ppm) (300 MHz, CDCl ₃) (塩フリー体のデータ) 0.12-0.23 (m, 2H), 0.51-0.64 (m, 2H), 0.84-0.98 (m, 1H), 1.28 (t, J=7.1 Hz, 3H), 1.81-1.91 (m, 1H), 2.24-2.63 (m, 8H), 2.65 (s, 3H), 2.66-2.69 (m, 1H), 2.70 (d, J=15.6 Hz, 1H), 2.72-2.80 (m, 1H), 2.84 (dd, J=18.4, 6.0 Hz, 1H), 2.95 (d, J=15.6 Hz, 1H), 3.16 (d, J=18.4 Hz, 1H), 3.39 (d, J=6.0 Hz, 1H), 3.74 (s, 3H), 4.18 (q, J=7.1 Hz, 2H), 4.60-4.74 (m, 1H), 4.78-4.91 (m, 1H), 5.83 (s, 1H), 6.60 (d, J=8.4 Hz, 1H), 6.62 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.36 (s, 1H), 7.41-7.51 (m, 1H), 7.51-7.62 (m, 1H), 8.04 (d, J=8.4 Hz, 1H), 8.43 (d, J=8.4 Hz, 1H).	融点 (°C). 元素分析値 組成式 計算値 実測値 IR (cm ⁻¹) Mass (EI) 606 (M ⁺). (塩フリー体のデータ)

化合物 89 メタンスルホン酸塩 収率 81 (%) 	NMR (ppm) (300 MHz, DMSO-d₆) 0.40-0.56 (m, 2H), 0.57-0.60 (m, 1H), 0.60-0.80 (m, 1H), 1.03-1.20 (m, 1H), 1.81-1.92 (m, 1H), 2.10-2.25 (m, 2H), 2.30 (s, 6H), 2.52-2.82 (m, 3H), 2.62 (s, 3H), 2.90-3.04 (m, 3H), 3.03 (d, J=15.6 Hz, 1H), 3.04-3.20 (m, 1H), 3.16 (d, J=7.8 Hz, 1H), 3.21-3.31 (m, 1H), 3.31-3.42 (m, 1H), 3.48 (d, J=15.6 Hz, 1H), 4.10 (d, J=7.8 Hz, 1H), 4.68-4.88 (m, 2H), 6.00 (s, 1H), 6.33 (s, 1H), 6.61 (d, J=7.8 Hz, 1H), 6.67 (d, J=7.8 Hz, 1H), 7.37 (s, 1H), 7.54 (t, J=7.8 Hz, 1H), 7.65 (t, J=8.3 Hz, 1H), 7.80 (br s, 2H), 8.05 (d, J=7.8 Hz, 1H), 8.42 (d, J=7.8 Hz, 1H), 8.96 (br s, 1H), 9.22 (s, 1H).	融点 200 (°C). 元素分析値 組成式 C ₃₆ H ₃₇ N ₃ O ₃ ·2.0CH ₃ SO ₃ H·0.4MeOH 計算値 C, 59.02; H, 6.34; N, 5.67; S, 8.66. 実測値 C, 58.90; H, 6.59; N, 5.64; S, 8.73. IR (cm⁻¹) (KBr) 3400, 1626, 1506, 1462, 1403, 1396, 1330, 1183, 1116, 1050, 864. Mass (FAB) 536 (M+H⁺).
化合物 90 メタンスルホン酸塩 収率 41 (%) 	NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.41-0.56 (m, 2H), 0.60-0.69 (m, 1H), 0.70-0.79 (m, 1H), 1.04-1.14 (m, 1H), 1.77-1.93 (m, 3H), 1.94-2.05 (m, 2H), 2.30 (s, 3.7H), 2.54-2.81 (m, 5H), 2.62 (s, 3H), 2.92-3.01 (m, 1H), 3.05 (d, J=16.1 Hz, 1H), 3.28 (dd, J=19.5, 6.4 Hz, 1H), 3.34-3.44 (m, 2H), 3.46 (d, J=19.5 Hz, 1H), 4.05 (d, J=6.4 Hz, 1H), 4.63-4.81 (m, 2H), 5.95 (s, 1H), 6.34 (br s, 1H), 6.61 (d, J=8.3 Hz, 1H), 6.64 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.36 (s, 1H), 7.52 (t, J=7.8 Hz, 1H), 7.64 (t, J=7.8 Hz, 1H), 8.05 (d, J=8.3 Hz, 1H), 8.42 (d, J=8.3 Hz, 1H), 8.95 (br s, 1H), 9.21 (br s, 1H).	融点 180 (°C). 元素分析値 組成式 C ₃₆ H ₃₇ N ₃ O ₃ ·1.2CH ₃ SO ₃ H·0.2H ₂ O 計算値 C, 65.84; H, 6.27; N, 6.19; S, 5.67. 実測値 C, 65.85; H, 6.40; N, 6.19; S, 5.67. IR (cm⁻¹) (KBr) 3412, 2370, 2300, 1638, 1510, 1460, 1423, 1400, 1315, 1189, 1048. Mass (EI) 559 (M⁺). (塩フリー体のデータ)
化合物 91 メタンスルホン酸塩 収率 88 (%) 	NMR (ppm) (400 MHz, DMSO-d₆) 0.41-0.56 (m, 2H), 0.60-0.69 (m, 1H), 0.70-0.79 (m, 1H), 1.06-1.17 (m, 1H), 1.84-1.92 (m, 1H), 2.18-2.24 (m, 1H), 2.30 (s, 3.3H), 2.31-2.42 (m, 1H), 2.58-2.81 (m, 3H), 2.63 (s, 3H), 2.92-3.06 (m, 1H), 3.04 (d, J=16.1 Hz, 1H), 3.12-3.20 (m, 1H), 3.22-3.32 (m, 1H), 3.35-3.45 (m, 1H), 3.47 (d, J=19.5 Hz, 1H), 3.88-4.05 (m, 2H), 4.11 (d, J=6.3 Hz, 1H), 4.70-4.90 (m, 2H), 6.00 (s, 1H), 6.36 (s, 1H), 6.61 (d, J=7.8 Hz, 1H), 6.64 (d, J=7.8 Hz, 1H), 7.37 (s, 1H), 7.54 (t, J=7.8 Hz, 1H), 7.68 (t, J=7.8 Hz, 1H), 8.06 (d, J=7.8 Hz, 1H), 8.45 (d, J=7.8 Hz, 1H), 8.95 (br s, 1H), 9.23 (br s, 1H).	融点 214 (°C). 元素分析値 組成式 C ₃₅ H ₃₅ N ₃ O ₃ S·1.1CH ₃ SO ₃ H·0.6H ₂ O 計算値 C, 62.45; H, 5.89; N, 6.05; S, 9.70. 実測値 C, 62.53; H, 6.04; N, 6.03; S, 9.49. IR (cm⁻¹) (KBr) (塩フリー体のデータ) 3400, 2926, 2192, 2114, 1636, 1620, 1506, 1454, 1398, 1379, 1321, 1218, 1149, 1116, 1033. Mass (EI) 577 (M⁺). (塩フリー体のデータ)

<p>化合物 <u>92</u> メタンсульホン酸塩 収率 66 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (500 MHz, DMSO-d₆) 0.40-0.48 (m, 1H), 0.48-0.54 (m, 1H), 0.60-0.70 (m, 1H), 0.73-0.80 (m, 1H), 1.05-1.17 (m, 1H), 1.83-1.93 (m, 1H), 2.03-2.12 (m, 1H), 2.13-2.26 (m, 1H), 2.30 (s, 3.5H), 2.64 (d, J=16.1 Hz, 1H), 2.62-2.80 (m, 2H), 2.93-3.00 (m, 1H), 3.07 (d, J=16.1 Hz, 1H), 3.12-3.19 (m, 1H), 3.28 (dd, J=20.0, 6.8 Hz, 1H), 3.36-3.43 (m, 3H), 3.46 (d, J=20.0 Hz, 1H), 4.11 (d, J=6.8 Hz, 1H), 4.66-4.79 (m, 2H), 6.01 (s, 1H), 6.35 (br s, 1H), 6.61 (d, J=7.8 Hz, 1H), 6.64 (d, J=7.8 Hz, 1H), 7.46 (t, J=7.8 Hz, 1H), 7.47-7.54 (m, 1H), 7.50 (d, J=1.4 Hz, 1H), 7.60 (d, J=6.8, 1.4 Hz, 1H), 7.97 (d, J=6.8 Hz, 1H), 8.18 (d, J=1.4 Hz, 1H), 8.31-8.35 (m, 1H), 8.39 (d, J=7.8 Hz, 1H), 8.95 (br s, 1H), 9.19 (br s, 1H).</p>
<p>融点 207 (°C). 元素分析値 組成式 C₃₄H₃₅N₃O₄·1.2CH₃SO₃H·0.2H₂O 計算値 C, 63.23; H, 6.06; N, 6.28; S, 5.76. 実測値 C, 63.25; H, 6.22; N, 6.20; S, 5.73. IR (cm⁻¹) (KBr) (塩フリー体のデータ) 3400, 1663, 1508, 1462, 1394, 1330, 1201, 1116, 1048. Mass (FAB) 550 (M+H⁺).</p>	<p>融点 (°C). 元素分析値 組成式 計算値 実測値 IR (cm⁻¹) (neat) (塩フリー体のデータ) 3400, 2366, 1636, 1611, 1562, 1508, 1421, 1386, 1286, 1158, 1123, 1052, 893. Mass (EI) 564 (M⁺). (塩フリー体のデータ)</p>
<p>化合物 <u>93</u> 収率 85 (%)</p> 	<p>NMR (ppm) (300 MHz, DMSO-d₆) (塩フリー体のデータ) 0.09-0.22 (m, 2H), 0.44-0.60 (m, 2H), 0.81-0.97 (m, 1H), 1.00-1.70 (m, 1H), 2.00-2.24 (m, 3H), 2.28-2.58 (m, 6H), 2.64-2.74 (m, 2H), 2.73 (d, J=15.6 Hz, 1H), 3.10 (d, J=20.0 Hz, 1H), 3.30-3.51 (m, 3H), 3.64 (s, 3H), 4.60-4.80 (m, 2H), 5.93 (s, 1H), 6.62 (d, J=7.8 Hz, 1H), 6.68 (d, J=7.8 Hz, 1H), 7.40-7.62 (m, 4H), 7.94 (d, J=7.8 Hz, 1H), 8.56 (d, J=7.8 Hz, 1H).</p>

[実施例 56]

グルタミン酸毒性に対する培養神経細胞保護作用

脳虚血、低酸素、あるいは外傷などによって、脳への血流が一時的に遮断されると、遅発性の脳神経細胞壊死が誘発されることが知られている〔文献：Brain Research, vol. 239, 57 (1982).〕。この神経細胞障害の1つの原因として、虚血に伴って過剰放出されるグルタミン酸などの興奮性神経伝達物質による興奮毒性が考えられている〔文献：Trends in Neuroscience, vol. 10, 299 (1987).〕。このグルタミン酸による細胞毒性に対して神経細胞保護作用を有する化合物は、本発明が解決しようとする課題である、様々な虚血性、出血性、または外傷性の脳障害、各種神経変性によって起こる脳神経細胞障害に対する抑制作用を発現し、これら障害から脳神経細胞を保護するような脳卒中、外傷性脳疾患、脳浮腫、脳神経変性疾患の治療・予防薬として有望である。この作用について、以下に述べる *in vitro* の評価系を用いて評価を実施した。

妊娠18~19日の Wistar 雌性ラットの腹中より、無菌条件下で胎児を取り出し、その頭部を開いて脳を摘出した。この脳を氷冷した L-15 培地中に置き、顕微鏡下大脳皮質部分を分離した。約 30 匹分の大脳皮質を細断後、0.25% trypsin 溶液 10 ml、0.01% DNase 溶液 0.2 ml に懸濁し、37℃ で 30 分間培養した。この後血清 2 ml を加えて直ちに 1200 rpm で 2 分間遠心し、沈殿部分を分離した。この沈殿に DF 培地 (Dulbecco 改変 Eagle 培地と F-12 培地を等量混合したものに、transferrin 20 nM、insulin 5 µg/ml、progesterone 20 nM、selenite 60 nM、penicillin 50 U/ml、streptomycin 50 U/ml を加えた培地) を 7 ml 加え、10 ml のプラスチックピペットで 20 回のピペッティング操作により細胞懸濁液を得、さらにナイロンメッシュ (孔径 43 µm) で濾過し単離細胞を分取した。得られた単離細胞を 6.0×10^5 cells/ml の濃度になるように DF 培地で希釈し、poly-lysine でプレコートされた 48 穴培養プレートに 500 µl ずつ撒き、37℃、5% CO₂ 存在条件下で 1 日間培養した。2 日目に新しい DF 培地に取り換え、蒸留水に溶解した 0.5 M グルタミン酸溶液を 10 µl ずつ各穴に添加し (最終グルタミン酸濃度は 10 mM)、37℃、5% CO₂ 存在条件下でさらに 24 時間培養した。被験化合物は蒸留水あるいは 10% もしくは 100% DMSO あるいは 10% メタ

ノールに溶解し、グルタミン酸を添加する直前に各穴に 5 μ l ずつ添加した。神経細胞障害の指標として、障害を受けた細胞から培地中に漏れ出てくる乳酸脱水素酵素 (LDH) の酵素活性を測定した。各被験化合物に対して、それぞれの濃度による LDH 漏出量を測定し、改変 Cochran-Armitage 法により用量反応曲線を求め、この直線から各被験化合物の 50% 有効濃度 (ED_{50}) を求めた。この結果を表 1 に示した。

【表 1】

グルタミン酸毒性に対する培養神経細胞保護作用

化合物	ED_{50} (μ M)	化合物	ED_{50} (μ M)	化合物	ED_{50} (μ M)
2	0.033	17	0.12	67	0.027
3	0.053	18	0.9	68	0.091
4	0.08	19	0.2	69	0.0093
5	0.12	20	0.027	70	0.015
6	0.4	22	0.05	71	0.019
7	0.2	24	0.8	72	0.026
8	0.2	25	0.3	77	0.16
9	0.11	59	0.11	79	0.19
11	0.138	60	0.093	80	0.037
12	0.035	61	0.14	81	0.067
13	0.093	63	0.15	83	0.073
14	0.086	65	0.11	84	0.039
15	0.15	66	0.4		

この結果、本発明のこれら化合物は、グルタミン酸による細胞毒性から神経細胞を保護する作用を有することが明らかになり、脳卒中、外傷性脳疾患、脳浮腫、脳神経変性疾患の治療・予防薬として有望であることがわかった。

【実施例 57】

ラット中大脳動脈虚血モデルにおける梗塞抑制作用

ヒトの脳梗塞急性期には、脳虚血が原因となって脳内血管の重篤な病変を伴う著明な脳浮腫が見られ、またこの脳梗塞急性期に血流が再開通すると、脳浮腫が

著しく増悪することもよく知られた事実である。このように、脳梗塞急性期においては、一般に梗塞中心部からその周辺組織へと病変が進展して、数日の時間経過と共に神経細胞壊死が拡大していくことが知られており、これに伴って後遺症を拡大・重篤化し、運動および精神機能を喪失させるだけでなく、最終的には生命にも重大な影響を及ぼすと考えられている。こうしたヒト脳梗塞患者の臨床病態に即し、薬物の臨床効果を的確に評価することができる *in vivo* の実験的脳梗塞モデルとして、Wistar 系ラットを用いた糸付き塞栓子による中大脳動脈閉塞 (MCAo; Middle Cerebral Artery occlusion) - 再開通モデルが知られている [文献: Japan Journal of Stroke, vol. 8, 1 (1986)]。このモデルにおいて梗塞抑制作用を示す化合物は、本発明の脳卒中、外傷性脳疾患、脳浮腫、脳神経変性疾患の治療・予防薬として有望であることは明白である。この作用について、このMCAoモデルを適用し、以下に述べる方法によって評価を実施した。

10週齢ラットにおいて、エーテル麻酔により導入した後、1.0% ハロタン麻酔下に頸部正中切開を加え、迷走神経の保存に留意しつつ、右頸動脈分岐部に達した。右頸動脈分岐部を中心に、総頸動脈および外頸動脈を周囲結合組織より剥離し、それぞれ 6-0 絹糸 (エトー糸 KK) にて結紮、さらに、内頸動脈起始部に糸を掛け塞栓挿入後の結紮・固定にそなえた。次いで、総頸動脈を切開し、同部より塞栓を内頸動脈に向けて約 15~16mm 挿入、塞栓のナイロン糸近位端を前述の絹糸で内頸動脈に結紮・固定した。以上の操作により、塞栓の先端は中大脳動脈分岐部を越えて、前大脳動脈内に約 1~2 mm 入り、塞栓の体部 (樹脂部) で中大脳動脈入口を 1 時間閉塞した。再開通は、糸付き塞栓子を引き抜き中大脳動脈へ血流を再開させた。被験化合物は、閉塞 10 分前と再開通 1 時間後にそれぞれ 3 mg/kg、腹腔内に投与した。閉塞-再開通 1 日後にて、心臓より全身性に生理食塩水を灌流し脳を摘出した。摘出した脳は氷水で 5 分間冷却後、2.0mm 間隔に 7 枚の大脳冠状面の切片を作製した。各切片において TTC (Triphenyltetrazolium Chloride) 染色を施した後、5% 中性緩衝ホルマリン溶液にて固定され、7 枚それぞれ右脳半球における梗塞面積を画像解析装置 (オリンパス) で測定し、梗塞体積 (mm^3) で表し評価した。この梗塞体積を対照群の梗塞体積と比較して、梗塞抑制率を算出した。この結果を表 2 に示した。

【表 2】

ラット中大脳動脈虚血モデルにおける梗塞抑制作用

化合物	梗塞抑制率 (%)	化合物	梗塞抑制率 (%)	化合物	梗塞抑制率 (%)
1	23	17	56	70	34
2	72	18	23	72	85
3	54	19	29	73	34
5	31	20	10	74	27
6	33	23	79	75	30
8	49	25	15	76	65
9	9	61	29	77	84
10	15	62	10	78	55
12	67	66	25	79	26
14	29	67	39	80	29
16	22	69	69	81	11

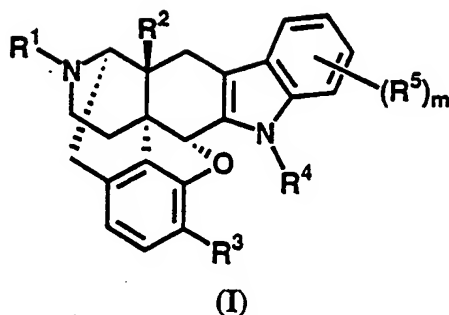
この結果、本発明のこれら化合物は、脳虚血の発生に伴って発生する様々な障害から脳神経細胞を保護して梗塞の進展を抑制し、脳梗塞の病態の増悪を防ぐ作用を有することが明らかとなった。従って、脳卒中、外傷性脳疾患、脳浮腫、脳神経変性疾患の治療・予防薬として有望であることがわかった。

産業上の利用可能性

上記実施例に示すように、本発明の化合物は、脳障害の治療または予防剤として有用であることが明らかになった。すなわち、本発明の化合物は、様々な虚血性、出血性、または外傷性の脳障害、各種神経変性によって起こる脳神経細胞障害を抑制することによって脳神経細胞を保護し、脳卒中、外傷性脳疾患、脳浮腫、脳神経変性疾患の治療・予防に関する有用な医薬品として利用できることが明らかになった。

請求の範囲

1. 一般式 (I)



〔式中、 R^1 は、水素、炭素数1～5のアルキル、炭素数4～7のシクロアルキルアルキル、炭素数5～7のシクロアルケニルアルキル、炭素数6～12のアリール、炭素数7～13のアラルキル、炭素数2～7のアルケニル、フラン-2-イルアルキル（ただし、アルキル部分の炭素数は1～5である）、またはチオフェン-2-イルアルキル（ただし、アルキル部分の炭素数は1～5である）を表し、

R^2 および R^3 は、独立して水素、ヒドロキシ、炭素数1～5のアルコキシ、炭素数1～5のアルカノイルオキシ、炭素数7～13のアラルキルオキシ、または炭素数7～13のアリールカルボニルオキシを表し、

R^4 は、水素、炭素数1～8のアルキル、炭素数7～13のアラルキル（ただし、1種以上の置換基 R^{15} により置換されていてもよい）、または R^6 を表し、

R^6 は、炭素数1～5のアルカノイル、炭素数7～13のアリールカルボニル（ただし、1種以上の置換基 R^{15} により置換されていてもよい）、炭素数1～5のアルキルスルホニル、炭素数6～12のアリールスルホニル（ただし、1種以上の置換基 R^{15} により置換されていてもよい）、炭素数7～13のアラルキルスルホニル（ただし、1種以上の置換基 R^{15} により置換されていてもよい）、または $(CH_2)_1-R^{16}$ を表し、

R^{15} は、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、炭素数1～5のアルキル、炭素数1～5のアルコキシ、イソチオシアナト、トリフ

ルオロメチル、トリフルオロメトキシ、またはシアノを表し、

i は、1～8の整数を表し、

R^{10} は、 OR^7 、 NR^7R^7 、ニトロ、シアノ、イソシアノ、イソシアナト、イソチオシアナト、 $COOR^7$ 、 $CONR^7R^7$ 、 NR^7CHO 、 $NR^7(CO)-R^9$ 、 $NR^7(CO)NR^9R^9$ 、 $NR^7(C=S)NR^9R^9$ 、 $NR^7(CO)O-R^9$ 、または $NR^7(C=S)O-R^9$ を表し（ここで、 R^7 、 R^7 、 R^9 はそれぞれ別個に水素または炭素数1～5のアルキルを表し、

R^9 は、炭素数1～5のアルキル、炭素数6～12のアリール（ただし、1種以上の置換基 R^{15} により置換されていてもよい）、ヘテロ原子数1～3で炭素数3～11のヘテロアリール（ただし、ヘテロ原子とはO、N、またはSであり、1種以上の置換基 R^{15} により置換されていてもよい）、炭素数7～13のアラルキル（ただし、1種以上の置換基 R^{15} により置換されていてもよい）、または炭素数8～15のアリールアルケニル（ただし、アリール部分が1種以上の置換基 R^{15} により置換されていてもよい）を表し、

m は0～4の整数を表し、

R^5 はベンゼン環上のm個の置換基であり、それぞれ別個にフルオロ、クロロ、ブロモ、アミノ、炭素数1～8のアルキル、炭素数3～7のシクロアルキル、炭素数1～5のアルコキシを表し（ただし、 R^4 が R^6 である場合には、 R^5 は R^{11} を表す）、または隣接する炭素にそれぞれ置換する2個の R^5 が一緒になって縮合環構造Aを表し（ただし、残る0～2個の R^5 は別個に R^{11} を表すかまたはもう1組の縮合環構造Aを表す）、

縮合環構造Aは、0～4個の置換基 R^{10} で置換されたベンゾ、インデノ、またはナフトを表し、

R^{10} および R^{11} は、①それぞれ別個にフルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ニトロ、炭素数1～8のアルキル、炭素数1～5のアルコキシ、イソチオシアナト、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、フェニル、炭素数1～3のヒドロキシアリール、 SR^{12} 、 SOR^{12} 、 SO_2R^{12} 、 $(CH_2)_kCO_2R^{12}$ 、 $SO_2NR^{13}R^{14}$ 、 $CONR^{13}R^{14}$ 、 $(CH_2)_kNR^{13}R^{14}$ 、または $(CH_2)_kN(R^{13})COR^{14}$ （ここで、kは0～5の整数を表し、 R^{12} は炭素数1～5のア

ルキルを表し、 R^{13} および R^{14} はそれぞれ別個に水素、炭素数1～5のアルキル、炭素数4～6のシクロアルキルアルキルを表す)を表し、および/または②環縮合部をはさんで隣接する炭素にそれぞれ置換する R^{10} と R^{11} とが一緒になって $R^{10}-R^{11}$ となりエタノ、プロパノ、または α -ベンゼノのいずれかの架橋構造を表し、

一般式(I)は、(+)体、(-)体、(±)体を含む]

で示されるインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩からなる脳障害治療・予防剤。

2. 一般式(I)において、 R^4 が水素、炭素数1～8のアルキル、または炭素数7～13のアラルキル(ただし、1種以上の置換基 R^{15} により置換されていてもよい)である、請求項1記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩からなる脳障害治療・予防剤。

3. 一般式(I)において、 R^4 が R^6 である、請求項1記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩からなる脳障害治療・予防剤。

4. 一般式(I)において、 R^5 が、それぞれ別個にフルオロ、クロロ、ブロモ、アミノ、炭素数1～8のアルキル、炭素数3～7のシクロアルキル、または炭素数1～5のアルコキシである、請求項2記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩からなる脳障害治療・予防剤。

5. 一般式(I)において、 m が2～4の整数であり、2個の R^5 が縮合環構造Aであり、残る0～2個の R^5 が別個に R^{11} を表すかまたはもう1組の縮合環構造Aである(Aおよび R^{11} は請求項1記載の定義に同じ)、請求項2記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩からなる脳障害治療・予防剤。

6. 一般式 (I) において、 R^5 が R^{11} であり、 R^{11} がそれぞれ別個にフルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ニトロ、炭素数1～8のアルキル、炭素数1～5のアルコキシ、イソチオシアナト、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、フェニル、炭素数1～3のヒドロキシアルキル、 SR^{12} 、 SOR^{12} 、 SO_2R^{12} 、 $(CH_2)_kCO_2R^{12}$ 、 $SO_2NR^{13}R^{14}$ 、 $CONR^{13}R^{14}$ 、 $(CH_2)_kNR^{13}R^{14}$ 、または $(CH_2)_kN(R^{13})COR^{14}$ (k 、 R^{12} 、 R^{13} 、および R^{14} は請求項1記載の定義に同じ) である、請求項3記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩からなる脳障害治療・予防剤。

7. 一般式 (I) において、 m が2～4の整数であり、2個の R^5 が縮合環構造Aであり、残る0～2個の R^5 が別個に R^{11} を表すかまたはもう1組の縮合環構造Aである (Aおよび R^{11} は請求項1記載の定義に同じ)、請求項3記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩からなる脳障害治療・予防剤。

8. 一般式 (I) において、 m が2～4の整数であり、2個の R^5 が縮合環構造Aであり、この縮合環構造Aがベンゾであり、残る0～2個の R^5 が R^{11} である (R^{11} は請求項1記載の定義に同じ)、請求項5記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩からなる脳障害治療・予防剤。

9. 一般式 (I) において、 m が2～4の整数であり、2個の R^5 が縮合環構造Aであり、この縮合環構造Aがインデノまたはナフトであり、残る0～2個の R^5 が R^{11} である (R^{11} は請求項1記載の定義に同じ)、請求項5記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩からなる脳障害治療・予防剤。

10. 一般式 (I) において、 m が4であり、2個の R^5 が縮合環構造Aであり、残る2個の R^5 がもう1組の縮合環構造Aである (Aは請求項1記載の定義に同じ)、請求項5記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される

酸付加塩からなる脳障害治療・予防剤。

1 1. 一般式 (I) において、 m が 2 ～ 4 の整数であり、2 個の R^6 が縮合環構造 A であり、この縮合環構造 A がベンゾであり、残る 0 ～ 2 個の R^6 が R^{11} である (R^{11} は請求項 1 記載の定義に同じ)、請求項 7 記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩からなる脳障害治療・予防剤。

1 2. 一般式 (I) において、 m が 2 ～ 4 の整数であり、2 個の R^6 が縮合環構造 A であり、この縮合環構造 A がインデノまたはナフトであり、残る 0 ～ 2 個の R^6 が R^{11} である (R^{11} は請求項 1 記載の定義に同じ)、請求項 7 記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩からなる脳障害治療・予防剤。

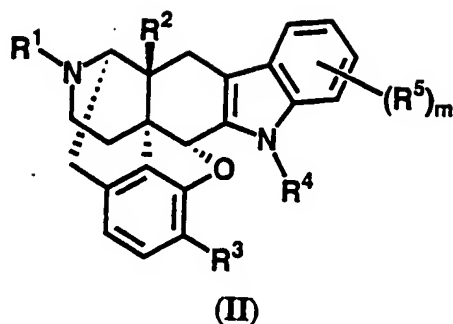
1 3. 一般式 (I) において、 m が 4 であり、2 個の R^6 が縮合環構造 A であり、残る 2 個の R^6 がもう 1 組の縮合環構造 A である (A は請求項 1 記載の定義に同じ)、請求項 7 記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩からなる脳障害治療・予防剤。

1 4. 上記記載の脳障害が脳卒中、外傷性脳疾患、脳浮腫、脳神経変性疾患、虚血障害疾患、または脳疾患後遺症である、請求項 1 記載の脳障害治療・予防剤。

1 5. 上記記載の脳障害が脳卒中である、請求項 1 4 記載の脳障害治療・予防剤

1 6. 上記記載の脳障害治療・予防剤が、虚血性、出血性、または外傷性の脳障害や神経変性疾患において、脳神経細胞への障害を抑制することを特徴とする脳神経細胞保護剤である、請求項 1 記載の脳障害治療・予防剤。

17. 一般式 (I I)



[式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^{15} 、 i 、 R^6 、 R^{16} 、 R^7 、 R^{17} 、 R^8 、 R^9 、 m 、 R^5 、 A 、 R^{10} 、 R^{11} 、 k 、 R^{12} 、 R^{13} 、および R^{14} はそれぞれ請求項1記載の定義に同じ（ただし、 R^4 が水素、炭素数1～8のアルキル、または炭素数7～13のアラルキルの場合には、 m が2～4の整数であり、2個の R^5 が縮合環構造Aであり、残る0～2個の R^5 が別個に R^{11} （ただし、この縮合環構造Aがベンゾの場合には、少なくとも1個の R^{10} と1個の R^{11} とが環縮合部をはさんで隣接する炭素にそれぞれ置換して一緒になった架橋構造 $R^{10}-R^{11}$ となりエタノ、プロパノ、または α -ベンゼノのいずれかでなくてはならない）またはもう1組の縮合環構造Aでなくてはならない）であり、

一般式 (I I) は、(+) 体、(-) 体、(±) 体を含む]

で表されるインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩

18. 一般式 (I I) において、 R^4 が水素、炭素数1～8のアルキル、炭素数7～13のアラルキル（ただし、1種以上の置換基 R^{15} により置換されていてもよく、 R^{15} は請求項1記載の定義に同じ）である、請求項17記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩。

19. 一般式 (I I) において、 R^4 が R^6 である（ R^6 は請求項1記載の定義に同じ）、請求項17記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩。

20. 一般式 (I I) において、 m が2～4の整数であり、2個の R^5 が縮合環構造Aであり、残る0～2個の R^5 が別個に R^{11} を表すかまたはもう1組の縮合環構造Aである (Aおよび R^{11} は請求項1記載の定義に同じ)、請求項18記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩。

21. 一般式 (I I) において、 R^5 が R^{11} であり、 R^{11} がそれぞれ別個にフルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ニトロ、炭素数1～8のアルキル、炭素数1～5のアルコキシ、イソチオシアナト、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、フェニル、炭素数1～3のヒドロキシアルキル、 SR^{12} 、 SOR^{12} 、 SO_2R^{12} 、 $(CH_2)_kCO_2R^{12}$ 、 $SO_2NR^{13}R^{14}$ 、 $CONR^{13}R^{14}$ 、 $(CH_2)_kNR^{13}R^{14}$ 、または $(CH_2)_kN(R^{13})COR^{14}$ (k 、 R^{12} 、 R^{13} 、および R^{14} は請求項1記載の定義に同じ) である、請求項19記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩。

22. 一般式 (I I) において、 m が2～4の整数であり、2個の R^5 が縮合環構造Aであり、残る0～2個の R^5 が別個に R^{11} を表すかまたはもう1組の縮合環構造Aである (Aおよび R^{11} は請求項1記載の定義に同じ)、請求項19記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩。

23. 一般式 (I I) において、 m が2～4の整数であり、2個の R^5 が縮合環構造Aであり、この縮合環構造Aがベンゾであり、残る0～2個の R^5 が R^{11} である (R^{11} は請求項1記載の定義に同じ)、請求項20記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩。

24. 一般式 (I I) において、 m が2～4の整数であり、2個の R^5 が縮合環構造Aであり、この縮合環構造Aがインデノまたはナフトであり、残る0～2個の R^5 が R^{11} である (R^{11} は請求項1記載の定義に同じ)、請求項20記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩。

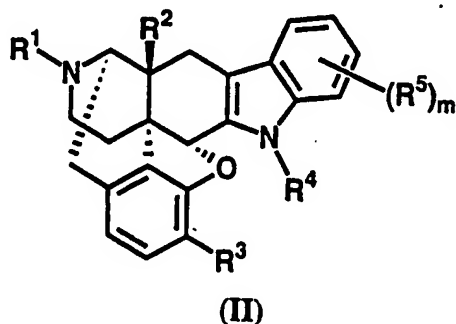
25. 一般式 (I I) において、 m が 4 であり、2 個の R^5 が縮合環構造 A であり、残る 2 個の R^5 がもう 1 組の縮合環構造 A である (A は請求項 1 記載の定義に同じ)、請求項 20 記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩。

26. 一般式 (I I) において、 m が 2 ~ 4 の整数であり、2 個の R^5 が縮合環構造 A であり、この縮合環構造 A がベンゾであり、残る 0 ~ 2 個の R^5 が R^{11} である (R^{11} は請求項 1 記載の定義に同じ)、請求項 22 記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩。

27. 一般式 (I I) において、 m が 2 ~ 4 の整数であり、2 個の R^5 が縮合環構造 A であり、この縮合環構造 A がインデノまたはナフトであり、残る 0 ~ 2 個の R^5 が R^{11} である (R^{11} は請求項 1 記載の定義に同じ)、請求項 22 記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩。

28. 一般式 (I I) において、 m が 4 であり、2 個の R^5 が縮合環構造 A であり、残る 2 個の R^5 がもう 1 組の縮合環構造 A である (A は請求項 1 記載の定義に同じ)、請求項 22 記載のインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩。

29. 一般式 (II)



[式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^{15} 、 i 、 R^6 、 R^{16} 、 R^7 、 $R^{7'}$ 、 R^8 、 R^9 、 m

、 R^5 、 A 、 R^{10} 、 R^{11} 、 k 、 R^{12} 、 R^{13} 、および R^{14} はそれぞれ請求項1記載の定義に同じ（ただし、 R^4 が水素、炭素数1～8のアルキル、または炭素数7～13のアラルキルの場合には、 m が2～4の整数であり、2個の R^5 が縮合環構造 A であり、残る0～2個の R^5 が別個に R^{11} （ただし、この縮合環構造 A がベンゾの場合には、少なくとも1個の R^{10} と1個の R^{11} とが環縮合部をはさんで隣接する炭素にそれぞれ置換して一緒になった架橋構造 $R^{10}-R^{11}$ となりエタノ、プロパノ、または α -ベンゼノのいずれかでなくてはならない）またはもう1組の縮合環構造 A でなくてはならない）であり、

一般式（II）は、（+）体、（-）体、（±）体を含む]

で表されるインドロモルヒナン誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩からなる医薬。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP98/00092

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl.⁶ C07D491/18, A61K31/485

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl.⁶ C07D491/18, A61K31/485

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAPLUS (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN), WPI/L (QUESTEL)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP, 3-218313, A (Toray Industries, Inc.), September 25, 1991 (25. 09. 91) (Family: none)	1-29
A	JP, 61-267517, A (CIBA-Geigy AG.), November 27, 1986 (27. 11. 86) & US, 4765985, A & US, 4680172, A & GB, 2171906, A & FR, 2578421, A	1-29
A	WO, 95/03308, A (Toray Industries, Inc.), February 2, 1995 (02. 02. 95) & EP, 663401, A1	1-29
A	WO, 95/03307, A (Toray Industries, Inc.), February 2, 1995 (02. 02. 95) & EP, 661283, A1	1-29
A	US, 4816586, A (Regents of the University of Minnesota), March 28, 1989 (28. 03. 89) (Family: none)	17-28

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.
 ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
April 7, 1998 (07. 04. 98)Date of mailing of the international search report
April 14, 1998 (14. 04. 98)Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP98/00092

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO, 94/14445, A (Toray Industries, Inc.), July 7, 1994 (07. 07. 94) & EP, 636371, A1 & US, 5714483, A	17-28

国際調査報告

国際出願番号 PCT/J P 98/00092

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.[°] C07D491/18, A61K31/485

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.[°] C07D491/18, A61K31/485

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAPLUS (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN), WPI/L (QUESTEL)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	J P, 3-218313, A (東レ株式会社) 25. 9月. 1991 (25. 09. 91) (ファミリーなし)	1-29
A	J P, 61-267517, A (チバーガイギー アクチェンゲゼ ルシャフト) 27. 11月. 1986 (27. 11. 86) &US, 4765985, A&US, 4680172, A&GB, 2171906, A&FR, 2578421, A	1-29
A	WO, 95/03308, A (東レ株式会社) 2. 2月. 1995 (02. 02. 95) &EP, 663401, A1	1-29

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的な技術水準を示すもの

「E」 先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

07. 04. 98

国際調査報告の発送日

14.04.98

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

富士 美香

電話番号 03-3581-1101 内線 6853

4C

9271

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	WO, 95/03307, A (東レ株式会社) 2. 2月. 1995 (02. 02. 95) &EP, .661283, A1	1-29
A	US, 4816586, A (Regents of the University of Minnesota) 28. 3月. 1989 (28. 03. 89) (ファミリーなし)	17-28
A	WO, 94/14445, A (東レ株式会社) 7. 7月. 1994 (07. 07. 94) &EP, 636371, A1&US, 5714483, A	17-28